

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 2.78 (3H, d, J=4.6Hz), 2.92 (6H, s), 3.12-3.19 (2H, m), 3.72 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.28 (1H, t, J=5.8Hz), 5.42 (2H, s), 7.10 (1H, s), 7.15 (1H, s), 7.23 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.37 (1H, q, J=4.6Hz), 8.92 (1H, brs), 9.52 (1H, brs)

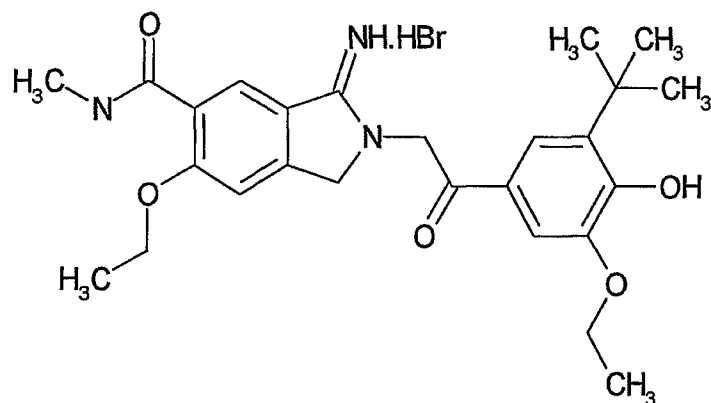
5

MS:m/e (ESI) 480.3 (MH⁺)

実施例 109

2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10



¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36-1.43 (15H, m), 2.82 (3H, d, J=4.6Hz), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.83 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.43 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.6Hz), 8.55 (1H, s).

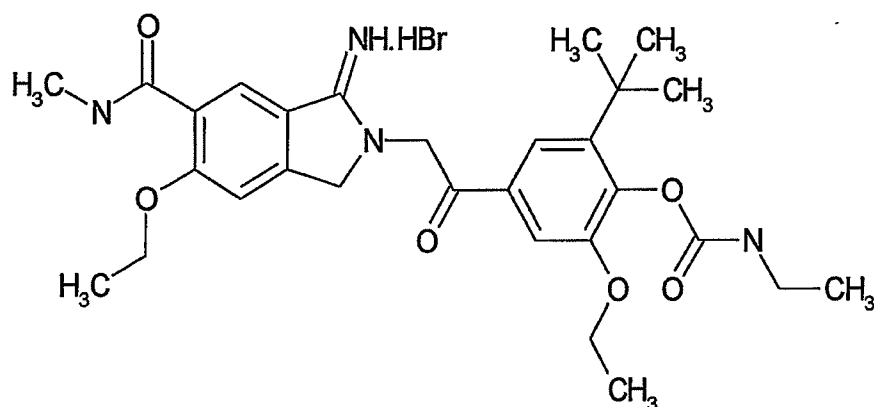
15

MS:m/e (ESI) 468.2 (MH⁺)

実施例 110

エチル-カルバミン酸 2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル

ル エステル;臭化水素酸塩



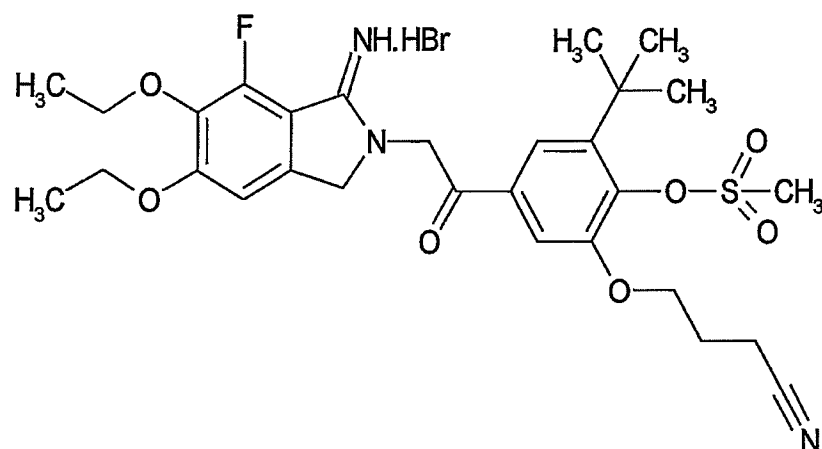
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 09 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 31 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 82
 5 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 05-3. 11 (2H, m), 4. 07 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 8
 5 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 86 (1H, t, J=6. 0Hz), 8
 . 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 539. 4 (MH⁺)

実施例 111

10 メタン sulfon酸 2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5, 6-ジエト
 キシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-
 フェニル エステル;臭化水素酸塩



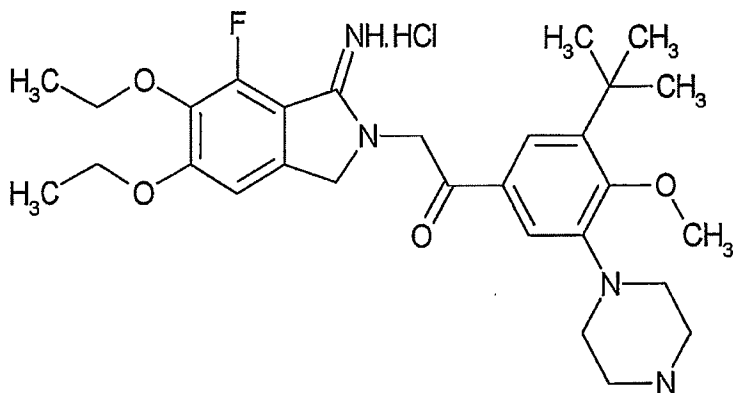
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 40 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 44 (9H, s), 2. 10-2. 17 (2H, m), 2. 69 (2H, t, J=7.2Hz), 3. 67 (3H, s), 4. 12 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 63 (1H, s), 7. 66 (1H, s), 9. 08 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 590. 2 (MH⁺)

実施例 112

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピペラジン-1-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;2 塩酸塩



¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

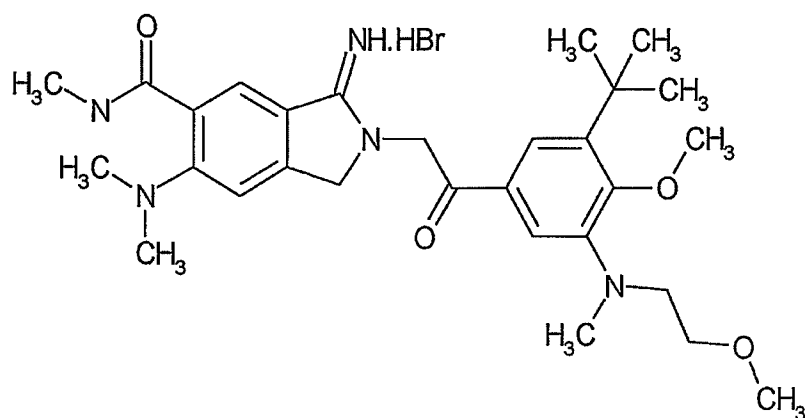
1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7.0Hz), 3. 21 (4H, brs), 3. 32 (4H, br

s), 3.94 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.64 (1H, s), 9.04-9.16 (3H, m), 9.40 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 527.3 (MH⁺)

実施例 113

- 5 2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル}-2-オキシ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩



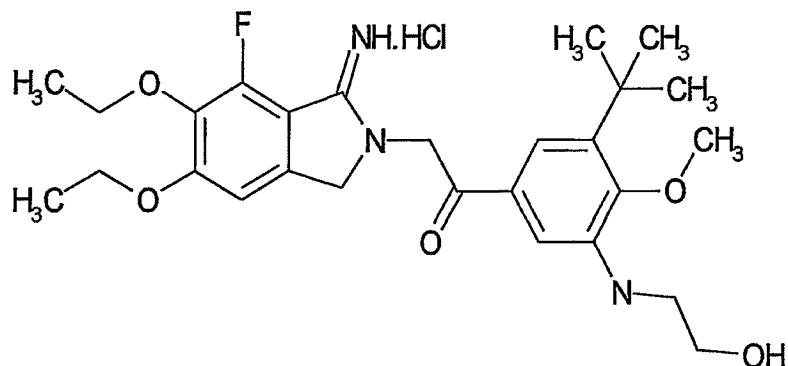
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.36 (9H, s), 2.77 (3H, d, J=4.0Hz), 2.80 (3H, s), 2.91 (6H, s), 3.18 (3H, s), 3.20-3.48 (4H, m), 3.81 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.36 (1H, q, J=4.0Hz).

MS:m/e (ESI) 524.3 (MH⁺)

実施例 114

- 15 1-[3-第3ブチル-5-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-エタノン;塩酸塩



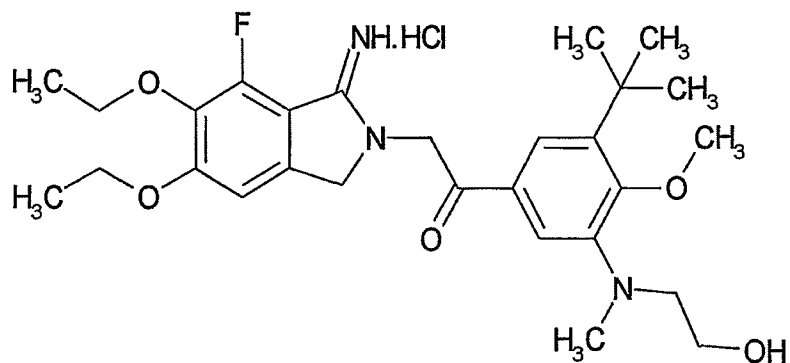
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45 (9H, s), 1. 50 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 44 (2H, t, J=5. 4Hz), 3. 83 (2H, t, J=5. 4Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 18 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 24 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 21 (1H, s), 7. 55 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 66 (1H, d, J=2. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 502. 3 (MH⁺)

実施例 115

1-{3-第 3 ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]-4-メトキシフェニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 2 塩酸塩



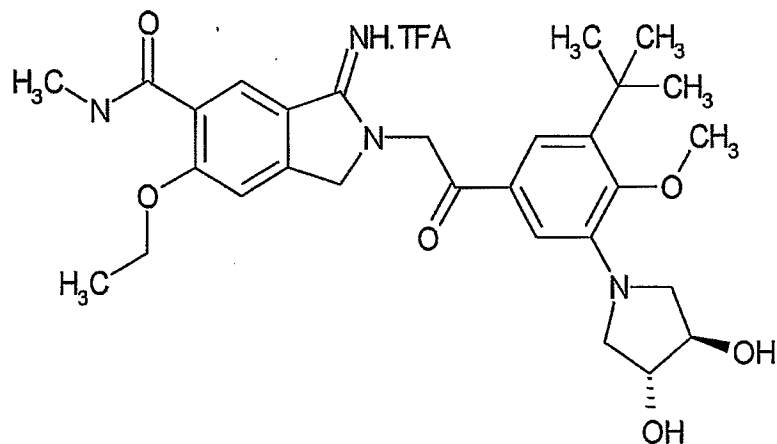
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 44 (9H, s), 1. 49 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 04 (3H, brs), 3. 38-3. 75 (4H, m), 3. 95 (3H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 21 (1H, s), 7. 77-7. 95 (2H, m).

MS:m/e (ESI) 516.4 (MH⁺)

実施例 116

2-[2-[3-第 3 ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

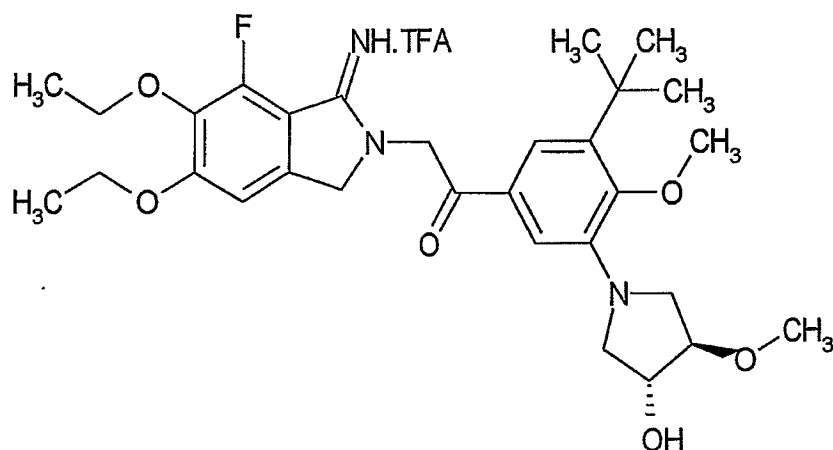


¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 2.88-2.95 (2H, m), 3.50-3.59 (2H, m), 3.61 (3H, s), 4.02 (2H, brs), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.83 (2H, s), 5.37-5.60 (2H, m), 7.29 (1H, s), 7.38 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.12-8.28 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.14 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

実施例 117

1-[3-第 3 ブチル-5-((3R,4R)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

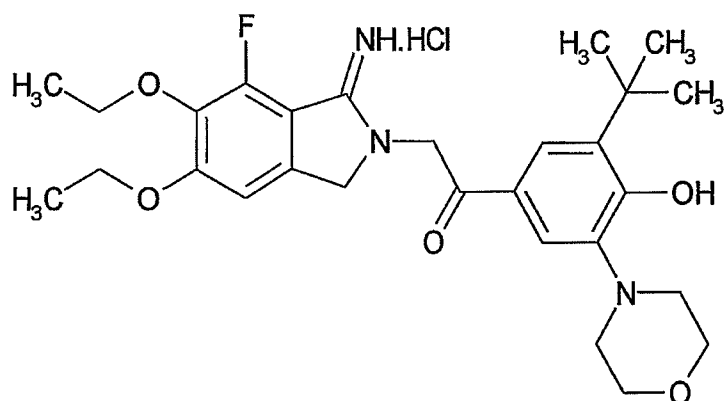


¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7.2Hz), 2. 91-2. 99 (1H, m), 3. 03-3. 12 (1H, m), 3. 30 (3H, s), 3. 40-3. 58 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 71-3. 79 (1H, m), 4. 10 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 10-4. 30 (3H, m), 4. 78 (2H, s), 5. 38-5. 60 (2H, m), 7. 30 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 41 (1H, s), 8. 99-9. 12 (1H, m), 9. 20-9. 40 (1H, m).

実施例 118

1-(3-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-5-モルフォリノフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;塩酸塩



¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

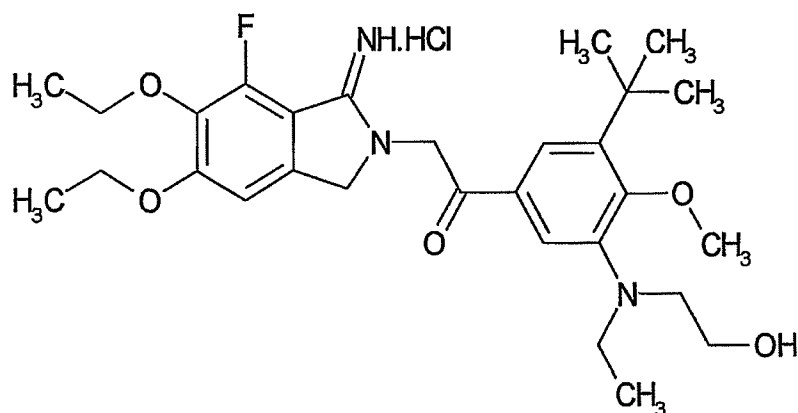
1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 38-1. 41 (12H, m), 2. 78-2. 79 (4H, m), 3. 81-3. 83 (4H, m), 4. 11

(2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.67 (1H, s), 7.73 (1H, s), 9.03 (1H, brs), 9.20 (1H, brs), 9.28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 514.3 (MH⁺)

実施例 119

- 5 1-{3-第3ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル;塩酸塩

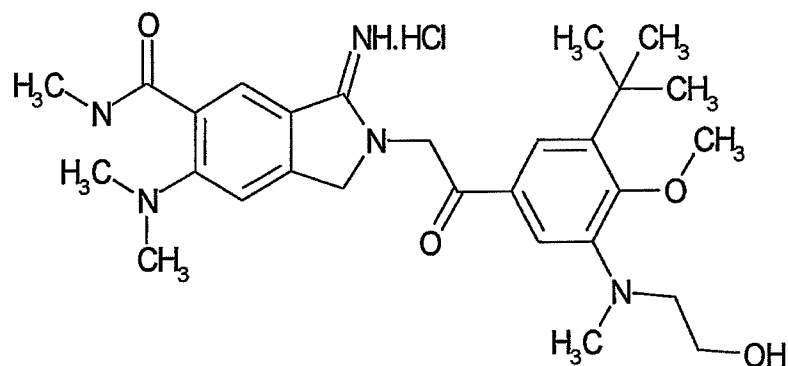


¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 0.96 (3H, t, J=6.4Hz), 1.28 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 3.14-3.26 (4H, m), 3.47 (2H, t, J=6.0Hz), 3.84 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.61 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.60 (1H, s), 9.10 (1H, brs), 9.57 (1H, brs).

実施例 120

- 15 2-(2-{3-第3ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;2塩酸塩

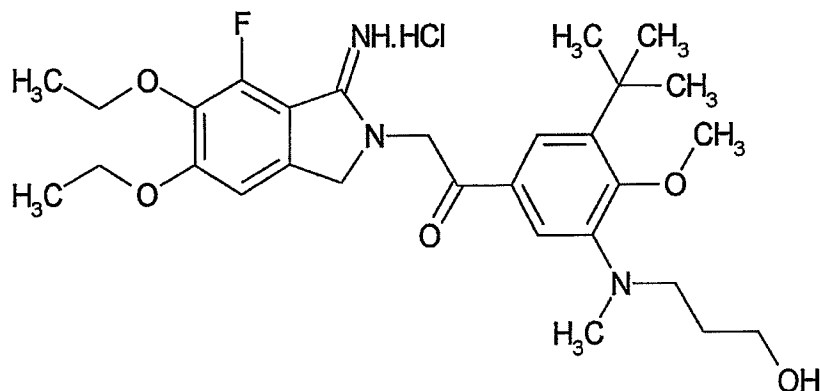


¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 2. 75 (3H, d, J=4. 0Hz), 2. 81 (3H, s), 2. 91 (6H, s), 3. 17 (2H, t, J=5. 6Hz), 3. 52 (2H, t, J=5. 4Hz), 4. 73 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 10 (1H, s), 8. 38 (1H, q, J=4. 0Hz), 9. 17 (1H, brs), 9. 65 (1H, brs).

実施例 121

1-{3-第3ブチル-5-[(3ヒドロキシプロピル)-メチルアミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-エタノン; 2 塩酸塩



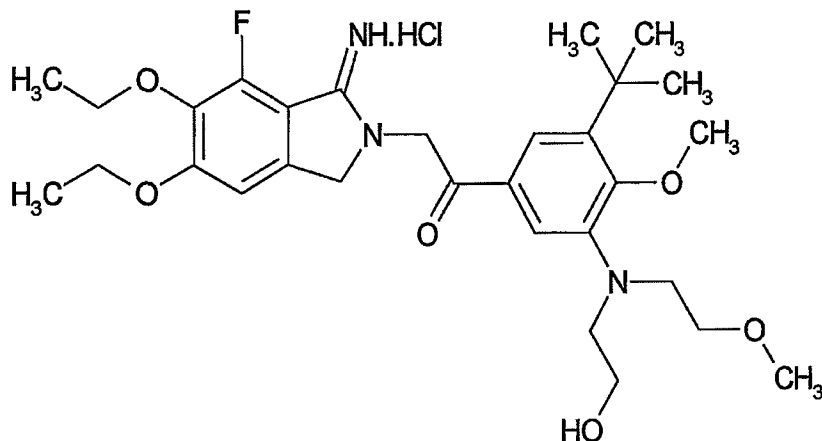
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 61 (2H, t, J=6. 4Hz), 2. 75 (3H, s), 3. 14 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 38 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 82 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 20 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 54 (1

H, s), 9.08 (1H, brs), 9.45 (1H, brs).

実施例 122

1-{3-第3ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-(2-メトキシエチル)-アミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 2 塩酸塩

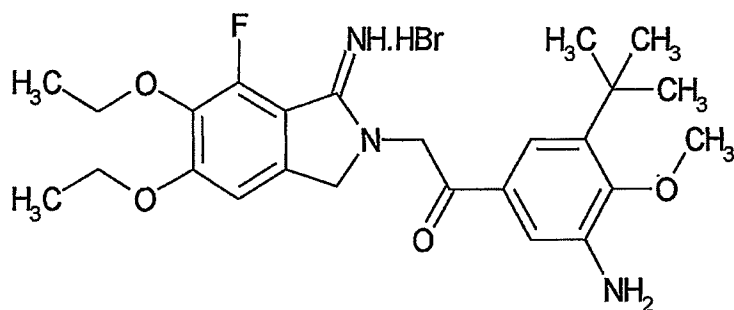


¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=7.2Hz), 3.15 (3H, s), 3.28 (2H, t, J=6.0Hz), 3.20-3.78 (4H, m), 3.46 (2H, t, J=6.0Hz), 3.82 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.2Hz), 4.21 (2H, q, J=7.2Hz), 4.79 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.58 (1H, s), 9.06 (1H, brs), 9.39 (1H, brs).

実施例 123

1-(3-アミノ-5-第3ブチル-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 38 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1. 43 (9H, s), 1. 50 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 3. 85 (3H, s), 4. 17 (2H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 4. 24 (2H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 4. 82 (2H, s), 5. 39 (2H, s), 7. 19 (1H, s), 7. 44 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7. 48 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$).

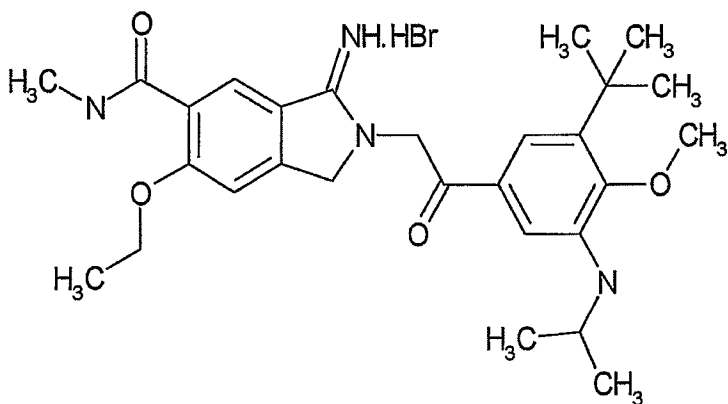
5

MS:m/e (ESI) 458. 2 (MH^+)

実施例 124

2-[2-(3-第3ブチル-5-イソプロピルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10



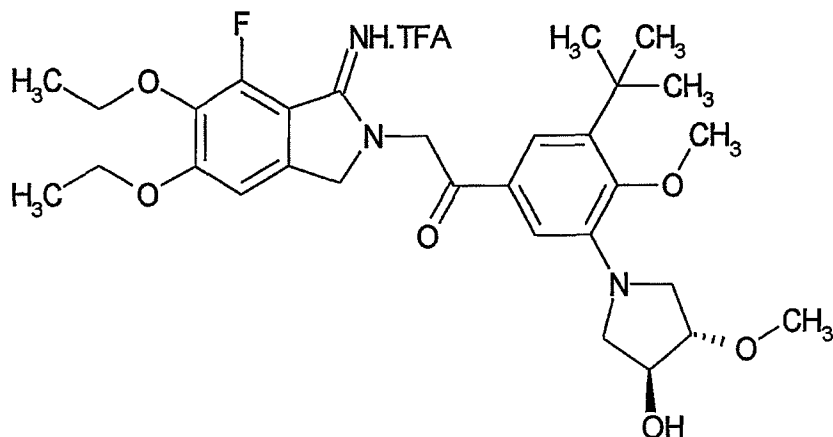
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 19 (6H, d, $J=6.0\text{Hz}$), 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2. 82 (3H, d, $J=4.4\text{Hz}$), 3. 60-3. 78 (1H, m), 3. 71 (3H, s), 4. 28 (2H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 4. 83 (2H, s), 4. 90 (1H, d, $J=6.0\text{Hz}$),

5. 46 (2H, s), 7. 14 (1H, s), 7. 22 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 20 (1H, d, J=4. 4Hz), 8. 55 (1H, s).

実施例 125

5 1-[3-第3ブチル-5-((3S, 4S)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; トリフルオロ酢酸塩



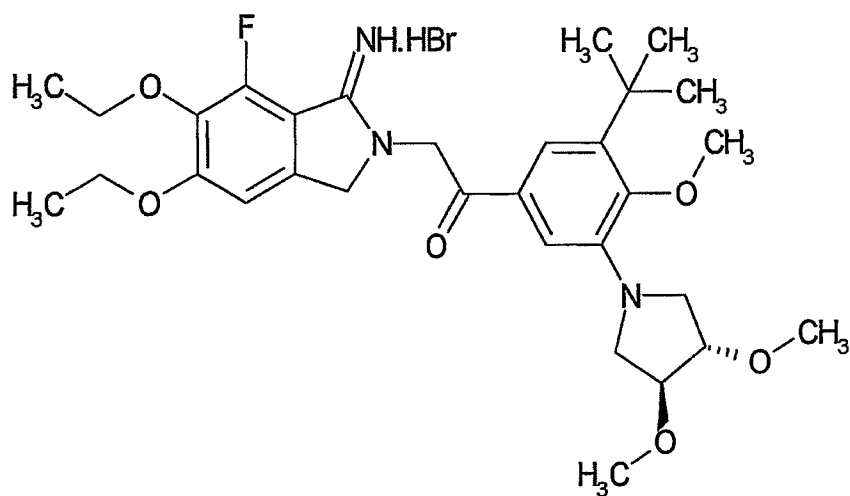
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 91-2. 99 (1H, m), 3. 03-3. 12 (1H, m), 3. 30 (3H, s), 3. 40-3. 58 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 71-3. 79 (1H, m), 4. 10 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 10-4. 30 (3H, m), 4. 78 (2H, s), 5. 38-5. 60 (2H, m), 7. 30 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 41 (1H, s), 8. 99-9. 12 (1H, m), 9. 20-9. 40 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 558. 3 (MH⁺)

実施例 126

15 1-[3-第3ブチル-5-((3S, 4S)-3, 4-ジメトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩



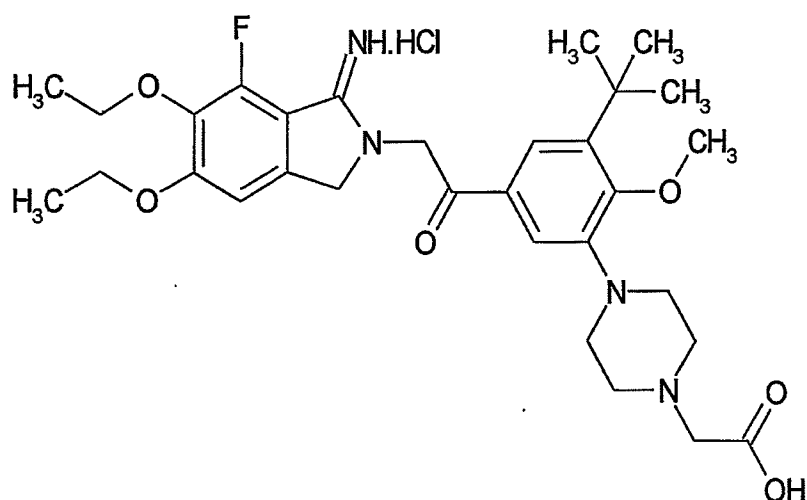
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 28 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 3. 03-3. 16 (2H, m), 3. 29 (6H, s), 3. 36-3. 52 (2H, m), 3. 64 (3H, s), 3. 91 (2H, brs), 4. 11 (2H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 4. 21 (2H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 4. 78 (2H, s), 5. 36-5. 62 (2H, m), 7. 33 (2H, s), 7. 44 (1H, s), 8. 95-9. 35 (2H, m).

MS: m/e (ESI) 572. 4 (MH^+)

実施例 127

10 (4-{3-第 3 プチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸; 2 塩酸塩



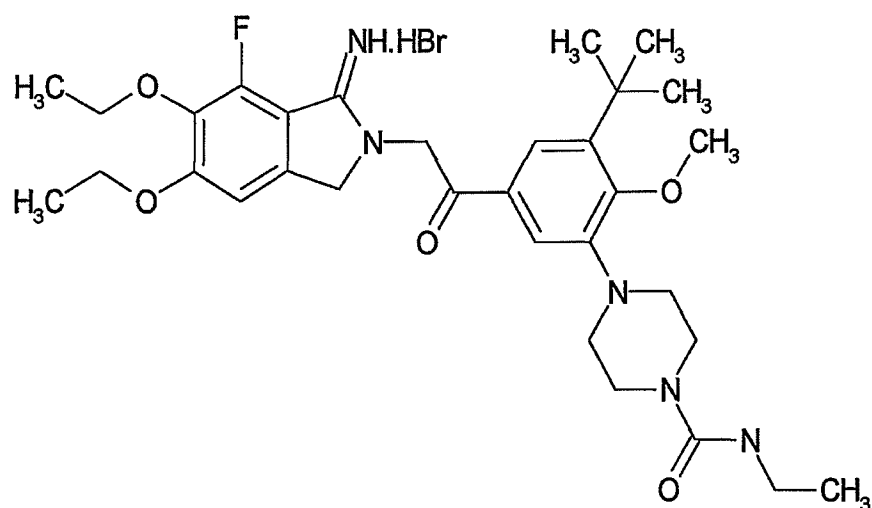
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 29 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 1. 38 (9H, s), 1. 40 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 3. 10-3. 69 (10H, m), 3. 93 (3
 5 H, s), 4. 12 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4. 21 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4. 22 (2H, brs), 4. 80 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 9. 10 (1H, brs), 9. 40 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 585. 3 (MH^+)

実施例 128

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
 10 ソインドール 1-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペラジン-1-カル
 ボン酸エチルアミド;臭化水素酸塩



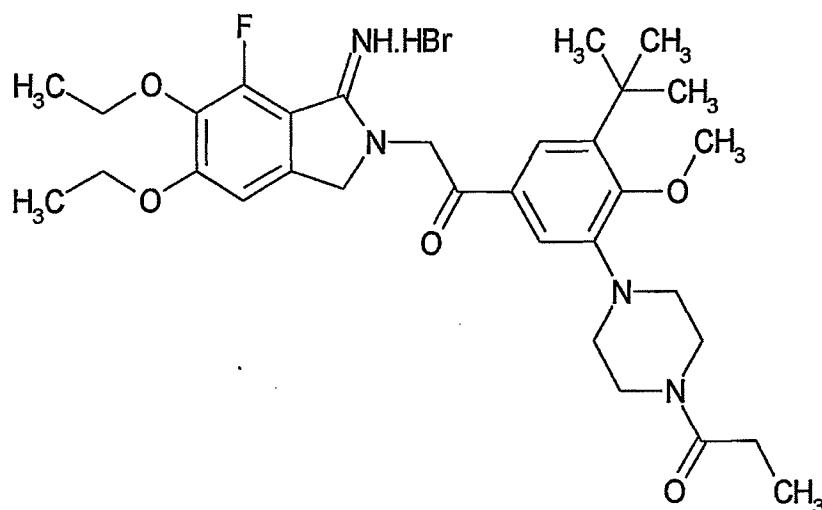
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.01 (3H, t, J=7.0Hz), 1.30 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 2.93 (4H, brs), 3.02-3.08 (2H, m), 3.49 (4H, brs), 3.95 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.22 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.60 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 598.3 (MH⁺)

実施例 129

1-(4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペラジン-1-イル)-プロパン-1-オン;臭化水素酸塩



¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 00 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 36
 (2H, q, J=7. 0Hz), 2. 94 (2H, brs), 2. 98 (2H, brs), 3. 66 (4H, brs), 3. 96 (3H, s), 4. 11 (2H
 5 , q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 50 (1H,
 d, J=2. 0Hz), 7. 61 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 06 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 583. 4 (MH⁺)

実施例 130

10 1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イ
 ソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 60 (18H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 62-7. 83 (5H, m), 8. 05 (1H, s), 8. 13-8. 22 (1
 H, m), 9. 21 (1H, brs), 9. 90 (1H, brs).

実施例 131

15 1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-5-メトキシ-1, 3-
 ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 3. 88 (3H, s), 4. 78 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 24 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 35 (1H,

s), 7.77 (2H, s), 8.10 (1H, d, J=8.8Hz), 9.04 (1H, brs), 9.71 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 409.1 (MH⁺)

実施例 132

5 N-{2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (18H, s), 2.10 (3H, s), 4.77 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.59-7.71 (2H, m), 7.76 (2H, s),
8.01-8.12 (1H, s), 8.68 (1H, s), 9.19 (1H, brs), 9.99 (1H, brs), 10.37 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 436.1 (MH⁺)

10 実施例 133

N-{2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-1-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.42 (18H, s), 2.12 (3H, s), 4.81 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.69 (1H, d, J=8.4Hz), 7.77 (2H,
15 s), 8.00-8.20 (3H, m), 9.07 (1H, brs), 9.76 (1H, brs), 10.51 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 436.1 (MH⁺)

実施例 134

20 N-{2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-メタン sulfon アミド;臭化
水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.42 (18H, s), 3.11 (3H, s), 4.80 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.53 (1H, d, J=8.8Hz), 7.73 (1H,
d, J=8.8Hz), 7.75 (2H, s), 8.08 (1H, s), 9.22 (1H, brs), 10.02 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 472.1 (MH⁺)

25 実施例 135

N-{2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-1-イ

ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-メタンスルホンアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1.40 (18H, s), 3.16 (3H, s), 4.81 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.37 (1H, d, J=8.8Hz), 7.50 (1H, s), 7.76 (2H, s), 8.10 (1H, d, J=8.8Hz), 9.07 (1H, brs), 9.97 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 472.1 (MH⁺)

実施例 136

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-6-イソプロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.32 (6H, d, J=6.0Hz), 1.42 (18H, s), 4.52-4.70 (1H, m), 4.76 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.33 (1H, d, J=8.4Hz), 7.64 (1H, d, J=8.4Hz), 7.77 (2H, s), 7.82 (1H, s.), 9.21 (1H, brs), 9.78 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 437.1 (MH⁺)

15 実施例 137

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-5-イソプロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.31 (6H, d, J=6.0Hz), 1.42 (18H, s), 4.68-4.81 (1H, m), 4.77 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.19 (1H, d, J=9.6Hz), 7.32 (1H, s), 7.77 (2H, s.), 8.02-8.19 (3H, m), 9.03 (1H, brs), 9.70 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 437.2 (MH⁺)

実施例 138

25 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-6-(2-メトキシ-エトキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H. s), 3. 32 (3H. s), 3. 71 (2H. t. J=4. 4Hz), 4. 17 (2H. t. J=4. 4Hz), 4. 77 (2H. s),
5. 51 (2H. s), 7. 40 (1H. d. J=8. 4Hz), 7. 67 (1H. d. J=8. 4Hz), 7. 78 (2H. s), 7. 85 (1H. m), 8
. 08 (1H. brs), 9. 24 (1H. brs), 9. 80 (1H. s).

MS:m/e (ESI) 453. 2 (MH⁺)

5 実施例 139

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-5-(2-メトキシ-エ
トキシ)-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H. s), 3. 30 (3H. s), 3. 66-3. 75 (2H. m.), 4. 19-4. 31 (2H. m.), 4. 78 (2H. s), 5. 47
10 (2H. s), 7. 24 (1H. d. J=8. 8Hz), 7. 35 (1H. s), 7. 77 (2H. s). 8. 07 (1H. brs), 8. 10 (1H. d. J
=8. 8Hz), 9. 06 (1H. brs), 9. 74 (1H. s).

MS:m/e (ESI) 453. 1 (MH⁺)

実施例 140

N-{2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-1-イ
15 ミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-N-メチル-アセトアミド; 臭化水
素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H. s), 2. 48 (3H. s), 3. 25 (3H. s), 4. 85 (2H. s), 5. 51 (2H. s), 7. 66 (1H. d, J=9. 0H
z), 7. 76 (3H. s), 8. 10 (1H. s), 8. 21 (1H. d, J=9. 0Hz), 9. 26 (1H. s), 9. 94 (1H. s).

20 MS:m/e (ESI) 450. 2 (MH⁺)

実施例 141

N-{2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イ
25 ミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-N-メチル-アセトアミド; 臭化水
素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H. s), 2. 48 (3H. s), 3. 25 (3H. brs), 4. 86 (2H. s), 5. 53 (2H. s), 7. 75-7. 83 (2H. m

), 8.10 (1H, s), 8.16 (1H, s), 9.29 (1H, s), 9.94 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 450.2 (MH⁺)

実施例 142

5 {2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミ
ノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-ウレア;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (18H, s), 4.74 (2H, s), 5.49 (2H, s), 6.12 (2H, s), 7.54-7.62 (2H, m), 7.77 (2H, s),
8.08 (1H, s), 8.43 (1H, s), 9.07 (1H, s), 9.21 (1H, s), 9.94 (1H, s).

実施例 143

10 {2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-1-イミ
ノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-ウレア;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (18H, s), 4.76 (2H, s), 5.43 (2H, s), 6.19 (2H, s), 7.48 (1H, d, J=7.7Hz), 7.57 (2H,
s), 7.97 (1H, s), 8.0 (1H, d, J=7.7Hz), 8.07 (1H, s), 8.98 (1H, s), 9.22 (1H, s), 9.66 (1H
15 , s).

実施例 144

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-7-イソプロポキシ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.40 (6H, d, J=7.6Hz), 1.42 (18H, s), 4.78 (2H, s), 4.87-5.02 (1H, m), 5.49 (2H, s), 7.2
6 (1H, d, J=8.4Hz), 7.30 (1H, d, J=8.4Hz), 7.82 (1H, t, J=8.4Hz), 7.77 (2H, s), 8.04 (1H
. brs), 8.08 (1H, s), 9.22 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 437.2 (MH⁺)

実施例 145

25 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-6-メトキシ-1,3-
ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H. s), 3. 84 (3H. s), 4. 77 (2H. s), 5. 52 (2H. s), 7. 38 (1H. d. J=8. 4Hz), 7. 67 (1H. d. J=8. 4Hz), 7. 78 (2H. s), 7. 86 (1H. s), 8. 08 (1H. brs), 9. 25 (1H. brs), 9. 85 (1H. brs).

MS:m/e (ESI) 409. 1 (MH⁺)

5 実施例 146

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(6-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H. s), 4. 85 (2H. s), 5. 52 (2H. s), 7. 71 (1H. dd. J=8. 8 and 8. 4Hz), 7. 77 (2H. s), 7. 80-7. 88 (1H. m.), 8. 06 (1H. d. J=8. 8Hz).

10

MS:m/e (ESI) 397. 2 (MH⁺)

実施例 147

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H. s), 4. 86 (2H. s), 5. 51 (2H. s), 7. 52-7. 61 (1H. m.), 7. 69 (1H. d. J=8. 4Hz), 7. 77 (2H. s), 8. 22-8. 31 (1H. m.), 9. 24 (1H. brs), 9. 92 (1H. brs).

MS:m/e (ESI) 397. 1 (MH⁺)

実施例 148

20

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;2 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H. s), 4. 91 (2H. s), 5. 58 (2H. s), 7. 75 (1H. dd, J=7. 1, 4. 8Hz), 7. 78 (2H. s), 8. 08 (2H. s), 8. 67 (1H. d, J=7. 1), 8. 94 (1H. d, J=4. 8Hz), 9. 56 (1H. s), 10. 27 (1H. s).

25

MS:m/e (ESI) 380. 1 (MH⁺)

実施例 149

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-6-(2-メトキシ-1,1-ジメチル-エトキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.22 (6H. s), 1.41 (18H. s), 3.16 (3H. s), 3.91 (2H. s), 4.77 (2H. s), 5.49 (2H. brs), 7.41 (1H. d. J=8.0Hz), 7.67 (1H. d. J=8.0Hz), 7.77 (2H. s), 7.85 (1H. s.), 8.09 (1H. brs), 9.22 (1H. brs), 9.95 (1H. brs).

MS:m/e (ESI) 481.3 (MH⁺)

実施例 150

- 10 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[6-(2-ヒドロキシ-1,1-ジメチル-エトキシ)-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.23 (6H. s), 1.41 (18H. s), 3.79 (2H. s), 4.75 (1H. s), 4.77 (2H. s), 5.49 (2H. s), 7.39 (1H. dd. J=8.4 and 2.4Hz), 7.66 (1H. d. J=8.4Hz), 7.77 (2H. s), 7.83 (1H. brs.), 8.08 (1H. brs), 9.21 (1H. brs), 9.75 (1H. brs).

MS:m/e (ESI) 467.2 (MH⁺)

実施例 151

- 20 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-6-イソブトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.00 (6H. d. J=6.8Hz), 1.41 (18H. s), 2.00-2.13 (1H. m), 3.81 (2H. d. J=6.8Hz), 4.77 (2H. s), 5.50 (2H. s), 7.38 (1H. d. J=8.8Hz), 7.65 (1H. d. J=8.0Hz), 7.77 (2H. s), 7.84 (1H. s.), 8.08 (1H. brs), 9.22 (1H. brs), 9.78 (1H. brs).

MS:m/e (ESI) 451.2 (MH⁺)

実施例 152

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1.41 (18H, s), 3.92 (3H, s), 4.96 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.77 (2H, s), 7.92 (1H, d, 8.0Hz), 8.09 (1H, s), 8.36 (1H, d, 8.0Hz), 8.91 (1H, s), 9.39 (1H, s), 10.09 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 437.1 (MH⁺)

実施例 153

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (18H, s), 4.92 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.67 (1H, s), 7.78 (2H, s), 7.96 (1H, d, J=8.0Hz), 8.09 (1H, s), 8.20 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.0Hz), 8.77 (1H, s), 9.34 (1H, s), 10.01 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 422.1 (MH⁺)

15 実施例 154

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.41 (18H, s), 4.92 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.70 (1H, s), 7.78 (2H, s), 8.10 (1H, s), 8.12 (1H, d, 7.8Hz), 8.21 (1H, s), 8.22 (1H, s), 8.27 (1H, d, 7.8Hz), 9.34 (1H, s), 10.01 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 422.2 (MH⁺)

実施例 155

2-(4or5-シアノ-2-イミノ-3-プロピル-ピロリジン-1-イル)-1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 4. 98 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 02 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 10 (1H, s), 8. 28 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 67 (1H, s), 9. 48 (1H, s), 10. 06 (1H, s), B: 1. 40 (18H, s), 4. 94 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 10, (1H, s), 8. 18 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 32 (1H, s), 8. 38 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 48 (1H, s), 10. 17 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 404. 1 (MH⁺)

実施例 156

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(6-ヒドロキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 41 (18H. s), 4. 71 (2H. s), 5. 48 (2H. s), 7. 20 (1H. d. J=8. 4Hz), 7. 48-7. 59 (2H. m), 7. 77 (2H. s), 8. 05 (1H. brs), 9. 12 (1H. brs), 9. 77 (1H. brs), 10. 22 (1H. s).

MS:m/e (ESI) 395. 1 (MH⁺)

実施例 157

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-ヒドロキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H. s), 4. 72 (2H. s), 5. 42 (2H. s), 7. 02 (1H. d. J=8. 4Hz), 7. 07 (1H. s), 7. 76 (2H. s), 8. 00 (1H. d. J=8. 4Hz), 8. 05 (1H. brs), 8. 93 (1H. brs), 9. 60 (1H. brs), 10. 78 (1H. brs).

20 MS:m/e (ESI) 395. 1 (MH⁺)

実施例 158

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-6-(2-メトキシ-1-メチル-エトキシ)-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン; 臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 26 (3H, d, J=6. 0Hz), 1. 42 (18H, s), 3. 29 (3H, s), 3. 46-3. 57 (2H, m), 4. 60-4. 68 (1H, m)

), 4.76 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.37 (1H, dd, J=8.4 and 2.4 Hz), 7.65 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.78 (2H, s), 7.87 (1H, brs), 8.05 (1H, brs), 9.22 (1H, brs), 9.79 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 467.2 (MH⁺)

実施例 159

- 5 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 ジメチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (18H, s), 2.94 (3H, s), 3.03 (3H, s), 4.91 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.77 (2H, s), 7.84 (1H, d, J=7.8 Hz), 7.86 (1H, d, J=7.8 Hz), 8.10 (1H, s), 8.32 (1H, s), 9.31 (1H, s), 9.93 (1H, s).

10

MS: m/e (ESI) 450.2 (MH⁺)

実施例 160

- 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸; 塩酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (18H, s), 4.94 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.77 (2H, s), 7.90 (1H, d, J=7.1 Hz), 8.09 (1H, s), 8.33 (1H, d, J=7.1 Hz), 8.91 (1H, s), 9.53 (1H, s), 10.13 (1H, s), 13.53 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 423.1 (MH⁺)

実施例 161

- 20 3-{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-1,1-ジメチル-ウレア; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (18H, s), 2.95 (6H, s), 4.75 (2H, s), 5.49 (1H, s), 7.61 (1H, d, J=7.9 Hz), 7.64 (1H, d, J=7.9 Hz), 7.77 (2H, s), 8.06 (1H, s), 8.48 (1H, s), 8.72 (1H, s), 9.15 (1H, s), 9.88 (1H, s).

25

MS:m/e (ESI) 465. 2 (MH⁺)

実施例 162

2-(6-第 3 ブチル-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3, 5-ジ-
第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (9H, s), 1. 41 (18H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 69 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 76 (2H, s), 7. 87 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 30 (1H, s), 9. 19 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

実施例 163

10 2-{2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イ
ミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル oxy}-プロパン酸;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 1. 55 (3H, d, J=6. 8Hz), 4. 75 (2H, s), 4. 90 (1H, q, J=6. 8Hz), 5. 49 (2H, s), 7. 34 (1H, dd, J=8. 8and2. 4Hz), 7. 65 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 73 (1H, brs), 7. 77 (2H, s), 8. 09 (1H, brs), 9. 22 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 467. 2 (MH⁺)

実施例 164

2-{2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イ
ミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イルオキシ}-2-メチル-プロパン酸;臭
化水素酸塩

20 1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 1. 59 (6H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 27 (1H, dd, J=8. 4and2. 4Hz), 7. 65 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 69 (1H, d, J=2. 4Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 08 (1H, brs), 9. 17 (1H, s), 9. 93 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 481. 2 (MH⁺)

25 実施例 165

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-6-メチル-1, 3-ジ

ヒドロ-ピロロ[3,4-c]ピリジン-2-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 2. 64 (3H, s), 4. 93 (2H, s), 5. 58 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 09 (1H, s), 8. 94 (1H, s), 9. 61 (1H, brs), 10. 27 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 394. 2 (MH⁺)

実施例 166

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジ
ヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 41 (18H, s), 2. 67 (3H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 63 (2H, s), 7. 70 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 78 (2H, s), 8. 08 (1H, brs), 8. 16 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 63 (1H, brs), 9. 94 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 394. 1 (MH⁺)

実施例 167

15 1-(7-第 3 ブチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-(1-イミ
ノ-6-イソプロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水
素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 30-1. 37 (21H, m), 4. 39 (2H, s), 4. 59-4. 71 (1H, m), 4. 77 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 34 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 65 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 72 (1H, s), 7. 80 (1H, s), 7. 82 (1H, s), 9. 25 (1H, brs), 9. 79 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 435. 1 (MH⁺)

実施例 168

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(6-エトキシ-1-イミノ-1,3-
ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 77 (2H, s), 5. 51 (2H, s),

7.36 (1H, dd, J=8.4 and 2.4 Hz), 7.66 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.78 (2H, s), 7.84 (1H, brs), 8.08 (1H, s), 9.22 (1H, brs), 9.81 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 423.1 (MH⁺)

実施例 169

- 5 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

- 1.36 (3H, t, J=6.8 Hz), 1.42 (18H, s), 4.16 (2H, q, J=6.8 Hz), 4.78 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.21 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.33 (1H, s), 7.78 (2H, s), 8.05 (1H, s), 8.12 (1H, d, J=8.8 Hz), 9.08 (1H, brs), 9.75 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 423.2 (MH⁺)

実施例 170

- 10 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-4,7-ジイソプロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

1.25 (6H, d, J=6.0 Hz), 1.38 (6H, d, J=6.0 Hz), 1.42 (18H, s), 4.64 (1H, qq, J=6.0 Hz, 6.0 Hz), 4.69 (2H, s), 4.87 (1H, qq, J=6.0 Hz, 6.0 Hz), 5.48 (2H, s), 7.24 (1H, d, J=9.2 Hz), 7.38 (1H, d, J=9.2 Hz), 7.76 (2H, s), 8.05 (1H, brs).

実施例 171

- 20 1-{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-3-メチル-ウレア;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

- 25 1.40 (18H, s), 2.67 (3H, s), 4.74 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.55 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.59 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.77 (2H, s), 8.06 (1H, s), 8.44 (1H, s), 8.97 (1H, s), 9.15 (1H, s), 10.40 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 451.2 (MH⁺)

実施例 172

{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-酢酸 メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.40 (18H, s), 3.64 (3H, s), 3.88 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.70 (1H, d, J=8.0Hz), 7.73 (1H, d, J=8.0Hz), 7.78 (2H, s), 8.02-8.10 (1H, br), 8.13 (1H, s), 9.94 (1H, s).

実施例 173

{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (18H, s), 3.74 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.69 (1H, d, J=8.0Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0Hz), 7.78 (2H, s), 8.14 (1H, s), 9.94 (1H, s).

実施例 174

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-4-イソプロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36-1.50 (24H, m), 4.79 (2H, s), 4.87-4.98 (1H, m), 5.50 (2H, s), 7.26 (1H, d, J=7.6Hz), 7.30 (1H, d, J=8.4Hz), 7.73 (1H, d, J=7.6Hz), 7.77 (2H, s), 8.03 (1H, brs), 8.07 (1H, brs), 9.23 (1H, brs).

- 20 実施例 175

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-6-(1-メトキシ-1-メチル-エチル)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.13 (t, J=6.8Hz), 1.41 (18H, s), 3.25 (3H, s), 3.66 (s), 4.12 (q, J=6.8Hz), 5.12 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.78 (2H, s), 7.79 (1H, d, J=6.8Hz), 7.86 (1H, d, J=6.8Hz), 8.39 (1H, s).

実施例 176

{2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-メトキシ-酢酸 エチルエステル; 臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 13 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 41 (18H, s), 3. 38 (3H, s), 4. 12 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 86 (2H, s), 5. 12 (1H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 78 (2H, m), 7. 79-7. 84 (2H, s), 8. 31 (1H, s).

実施例 177

10 2-{2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-3-メチル-酪酸;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

0. 67 (3H, d, $J=6.5$), 1. 04 (3H, d, $J=6.5$), 1. 17 (1H, t, $J=6.5$), 1. 41 (18H, s), 2. 25-2. 36 (1H, m), 4. 82 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 72 (1H, d, $J=7.0$), 7. 75 (1H, d, $J=7.0$), 7. 77 (2H, s), 8. 27 (1H, s), 10. 03 (1H, s).

15 MS: m/e (ESI) 479. 4 (MH $^+$)

実施例 178

2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 第 3 ブチル エステル;臭化水素酸塩

20 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 39 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 41 (18H, s), 1. 53 (9H, s), 4. 14 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 80 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 7. 83 (1H, s), 8. 02 (1H, s).

実施例 179

25 2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 41 (18H, s), 4. 15 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 53 (2H, s),
7. 78 (2H, s), 7. 87 (1H, s), 8. 05 (1H, s), 9. 06 (1H, s), 10. 05 (1H, s).

実施例 180

- 5 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 25-1. 41 (24H, m), 4. 08 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 14 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 71 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 75 (2H, s), 7. 81 (1H, s), 9. 05 (1H, brs), 9. 59 (1H, brs).

- 10 実施例 181

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(4,7-ジフルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

4. 77 (2H, s), 5. 19 (2H, s), 7. 49 (1H, m), 7. 60 (1H, m), 7. 68 (2H, s).

- 15 実施例 182

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[6-(2-ヒドロキシ-1-メチル-エトキシ)-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 25 (3H, d, J=6.4Hz), 1. 42 (18H, s), 3. 50-3. 63 (2H, m), 4. 42-4. 53 (1H, m), 4. 76 (2H, s), 4. 95 (1H, t, J=5.6Hz), 5. 50 (2H, s), 7. 36 (1H, brd, J=8.8Hz), 7. 64 (1H, d, J=8.8Hz), 7. 78 (2H, s), 7. 84 (1H, brs), 8. 08 (1H, brs), 9. 21 (1H, brs), 9. 78 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 453. 4 (MH⁺).

実施例 183

- 25 2-{2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イルオキシ}-酪酸;トリフルオロ酢酸

塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 02 (3H, t, J=6.8Hz), 1.42 (18H, s), 1.86-2.10 (2H, m), 4.68-4.83 (3H, m), 5.50 (2H, s), 7.36 (1H, dd, J=8.4 and 0.8Hz), 7.67 (1H, d, J=8.4Hz), 7.77 (1H, s), 7.78 (2H, s), 8.08 (1H, brs), 9.25 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 481.3 (MH⁺)

実施例 184

{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-メトキシ-酢酸;トリフルオロ酢酸

10 塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (18H, s), 3.38 (3H, s), 4.83 (2H, s), 4.99 (1H, s), 5.52 (2H, s), 7.77-7.83 (2H, m), 7.78 (2H, s), 8.07 (1H, br), 8.32 (1H, s), 9.29 (1H, brs), 9.95 (1H, brs).

実施例 185

15 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸;トリフルオロ酢酸
塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.37 (3H, t, J=6.8Hz), 1.41 (18H, s), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.83 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.53 (1H, s), 7.75 (2H, s), 8.49 (1H, s), 9.16 (1H, br), 9.78 (1H, br).

実施例 186

2-{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-2-メトキシ-プロパン酸;トリフルオロ酢酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (18H, s), 1.69 (3H, s), 3.18 (3H, s), 4.83 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.78 (3H, s), 7.86 (

1H, d, J=8.0Hz), 8.07 (1H, br), 8.41 (1H, s), 9.32 (1H, s), 9.99 (1H, s).

実施例 187

N-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-メタンスルホンアミド;塩酸塩

5

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

1.37 (9H, s), 2.66 (3H, s), 3.14 (6H, sX2), 4.05 (2H, s), 5.47-5.62 (2H, m), 7.70 (1H, d, J=8.0Hz), 7.81 (1H, s), 7.97 (1H, s), 8.16 (1H, d, J=8.0Hz), 9.57 (1H, brs), 9.95 (1H, s), 10.01 (1H, s).

10 MS:m/e(ESI) 445.2 (MH⁺)

実施例 188

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

15 1.40 (18H, s), 2.82 (3H, d, 5.3Hz), 4.91 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.77 (2H, s), 7.85 (1H, d, J=8.1Hz), 8.03-8.12 (1H, br), 8.21 (1H, d, J=8.1Hz), 8.70 (1H, q, J=5.3Hz), 8.74 (1H, s), 10.05 (1H, s).

実施例 189

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

20

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

1.40 (18H, s), 2.81 (3H, d, J=5.3Hz), 4.91 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.79 (2H, s), 8.08 (1H, s), 8.09 (1H, d, =8.1Hz), 8.17 (1H, s), 8.31 (1H, d, J=8.1Hz), 8.74 (1H, q, J=5.3), 9.44 (1H, s), 8.74 (1H, s), 10.05 (1H, s) 10.12 (1H, s).

25 実施例 190

2-{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イ

ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-2-メトキシ-プロピオンアミド;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1.41 (18H, s), 1.68 (3H, s), 3.18 (3H, s), 4.83 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.34 (1H, brs), 7.43 (1H, brs), 7.74-7.78 (1H, m), 7.77 (2H, s), 7.84 (1H, d, J=8.0Hz), 8.34 (1H, s).

実施例 191

2-{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-2-メトキシ-N-メチル-プロピオ
ンアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (18H, s), 1.69 (3H, s), 2.58 (3H, d, J=4.4Hz), 3.18 (3H, s), 4.83 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.71-7.82 (2H, m), 7.85 (2H, s), 7.99 (1H, brs), 8.31 (1H, s).

実施例 192

15 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-プロピル-5,7-
ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.93 (3H, t, J=7.2Hz), 1.41 (18H, s), 1.70-1.83 (2H, m), 2.89 (2H, t, J=7.6Hz), 4.84 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.71 (1H, d, J=8.0Hz), 7.77 (2H, s), 8.08 (1H, s), 8.17 (1H, d, J=8.0Hz), 9.52 (1H, brs), 9.85 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 422.2 (MH⁺)

実施例 193

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ
-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-スルホン酸ジメチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.40 (18H, s), 2.67 (6H, s), 4.99 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.77 (2H, s), 8.06 (1H, d, J=8.1Hz), 8.16 (1H, d, J=8.1Hz), 8.73 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 486.2 (MH⁺)

実施例 194

2-{2-[3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 ジメチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (18H, s), 2. 95 (3H, s), 3. 03 (3H, s), 3. 15 (6H, s), 4. 92 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 81-7. 88 (3H, m), 7. 97 (1H, s), 8. 32 (1H, s), 9. 39 (1H, s), 9. 95 (1H, s), 10. 04 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 501.2 (MH⁺)

10 実施例 195

({2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボニル}-メチル-アミノ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 40 (18H, s), 3. 00 (3H, s), 4. 20 (2H, s), 4. 92 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 77-7. 88 (2H, m), 7. 78 (2H, s), 8. 09 (1H, s), 8. 24-8. 39 (1H, 2s), 9. 39 (1H, br), 9. 93-10. 03 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 494.3 (MH⁺)

実施例 196

20 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(4-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 25-1. 53 (21H, m), 4. 37 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 24-7. 31 (2H, m), 7. 68-7. 79 (3H, m), 8. 07 (1H, brs), 8. 32 (1H, brs), 9. 24 (1H, brs).

実施例 197

25 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-4-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 4. 00 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 25 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 29 (1H, d, J=7. 6Hz), 7. 51-7. 78 (3H, m), 8. 06 (1H, brs), 8. 64 (1H, brs), 9. 23 (1H, brs).

実施例 198

- 5 2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-1-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 81 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 7. 91 (1H, s), 7. 94 (1H, s), 8. 21-8. 23 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 480. 3 (MH⁺)

実施例 199

- 15 2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 8 --- 4 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s), 9 . 13 (1H, br), 9. 82 (1H, br).

MS: m/e (ESI) 480. 3 (MH⁺)

実施例 200

- 25 N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-N-メチル-メタン sulfon アミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (18H, m), 3. 14 (6H, s), 4. 07-4. 15 (4H, m), 4. 72 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 36 (1H, s),

7. 81 (2H, s), 7. 93 (1H, s), 9. 08 (1H, brs), 9. 60 (1H, brs).

実施例 201

2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ
-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 エチルアミド;臭化水素酸塩

5 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 15 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 40 (18H, s), 3. 27-3. 45 (2H, m), 4. 93 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 7
7 (2H, s), 7. 85 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 01-8. 23 (1H, m), 8. 22 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 70 (1H, s)
, 8. 72 (1H, s), 9. 34 (1H, s), 10. 01 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 450. 3 (MH⁺)

10 実施例 202

{2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミ
ノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-カルバミン酸 メチルエステル;臭
化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

15 1. 40 (18H, s), 3. 70 (3H, s), 4. 76 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 61 (1H, dd, J=8. 4, 1. 8Hz), 7. 6
7 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 07 (1H, brs), 8. 49 (1H, brs), 9. 20 (1H, s), 9. 99 (1H,
brs), 10. 12 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 452. 3 (MH⁺)

実施例 203

20 {2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-1-イミ
ノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-カルバミン酸 メチルエステル;臭
化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

25 1. 40 (18H, s), 3. 70 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 63 (1H, dd, J=8. 4, 1. 8Hz), 7. 7
7 (2H, s), 7. 92 (1H, s), 8. 09 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 06 (1H, brs), 9. 74 (1H, brs), 10. 33 (1H
, s).

MS:m/e (ESI) 452.3 (MH⁺)

実施例 204

3-{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-2-メチル-アクリル酸 エチルエ
ステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37 (3H, t, J=6.8Hz), 1.41 (18H, s), 2.08 (3H, s), 4.23 (2H, q, J=6.8Hz), 4.88 (2H, s),
5.22 (2H, s), 7.68 (1H, s), 7.77 (2H, s), 7.83-7.91 (2H, m), 8.32 (1H, s).

実施例 205

10 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-6-トリフルオロメ
チル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

4.98 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.78 (2H, s), 8.04 (1H, d, J=8.0Hz), 8.20 (1H, d, J=8.0z), 8.
69 (s, 1H).

15 実施例 206

3-{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-2,N-ジメチル-アクリルアミド
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.41 (18H, s), 2.05 (3H, s), 2.71 (3H, d, J=4.4Hz), 4.87 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.31 (1H,
s), 7.76-7.80 (2H, m), 7.78 (2H, s), 8.10 (1H, br), 8.30 (1H, s).

実施例 207

3-{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-2-メチル-アクリルアミド 臭化
水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 2. 05 (3H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 5. 76 (1H, s), 7. 22 (1H, br), 7. 34 (1H, s), 7. 63 (1H, brs), 7. 77 (3H, s), 7. 79 (1H, d, J=5. 2Hz), 8. 24 (1H, s).

実施例 208

5 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジクロロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

4. 53 (2H, s), 5. 66 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 80 (1H, s), 7. 90 (2H, s).

実施例 209

10 1-(7-第3ブチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (6H, s), 1. 34 (9H, s), 2. 67 (3H, s), 4. 39 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 54 (2H, brs), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 712 (1H, s), 7. 79 (1H, s), 8. 16 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 51 (1H, brs), 9. 95 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 392. 2 (MH⁺)

実施例 210

20 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メトキシメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 3. 41 (3H, s), 4. 67 (2H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 50-5. 52 (2H, m), 7. 78 (2H, s), 7. 85 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 08 (1H, brs), 8. 29 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 50-9. 52 (1H, m), 9. 99 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 424. 2 (MH⁺)

25 実施例 211

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メ

チル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 30-1.50 (2H, m), 2. 50 (3H, s), 4. 21 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 76 (3H, sX2), 8. 06 (1H, s), 9. 24 (1H, brs), 9. 74 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 438. 2 (MH⁺)

実施例 212

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-6-(ピペリジン-1-カルボニル)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 30-1. 70 (6H, m) 1. 40 (18H, s), 3. 28 (2H, m), 3. 60 (2H, m), 4. 88 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 79 (2H, s), 7. 81 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 85 (1H, d, J=8.4Hz), 8. 09 (1H, brs), 8. 27 (1H, s), 9. 34 (1H, brs) 9. 94 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 490. 3 (MH⁺)

実施例 213

15 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピラジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 2. 72 (3H, s), 4. 93 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 97 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 395. 2 (MH⁺)

20 実施例 214

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-ジメチルアミノメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 42 (18H, s), 2. 88 (6H, s), 4. 64 (2H, brs), 4. 96 (2H, s), 5. 58-5. 72 (2H, m), 7. 79 (2H, s), 7. 95-8. 05 (1H, m), 8. 10 (1H, s), 8. 37 (1H, d, J=8.4Hz), 9. 79-9. 91 (1H, m), 10. 03-10. 10 (1H, m), 10. 80-10. 96 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 437. 2 (MH⁺)

実施例 215

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-イミノ-4-メトキシメチル-3-フェニル-ピロリジン-1-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

5 1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 2. 64 (3H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 37 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 54-7. 67 (2H, m), 7. 79 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 393. 2 (MH⁺)

実施例 216

10 1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2, 4-ジメチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (18H, s), 2. 32 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 99 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 07 (1H, s), 9. 37 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 452. 2 (MH⁺)

実施例 217

20 2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-メトキシ-エチル)-アミド; 臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 3. 27 (3H, s), 3. 31 (2H, s), 3. 48 (2H, brs), 4. 91 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 7. 86 (1H, d, J=8. 0), 8. 09 (1H, brs), 8. 23 (1H, d, J=8. 0), 8. 72 (1H, s), 8. 77 (1H, brs), 9. 24 (1H, brs), 10. 03 (1H, brs).

25 実施例 218

2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ

-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 イソプロピルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1.18 (6H, d, J=6.9), 1.40 (18H, s), 4.05-4.16 (1H, m), 4.91 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.77 (2H, s), 7.85 (1H, d, J=8.0), 8.08 (1H, s), 8.23 (1H, dd, J=8.0, 1.1Hz), 8.48 (1H, d, J=7.8Hz), 8.68 (1H, s), 9.32 (1H, brs), 10.00 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 464.3 (MH⁺)

実施例 219

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-スルホン酸アミド;臭化水素酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (18H, s), 4.95 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.64 (2H, s), 7.77 (2H, s), 7.99 (1H, d, J=7.9), 8.09 (1H, brs), 8.23 (1H, d, J=7.9), 8.75 (1H, s), 10.14 (1H, brs).

実施例 220

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-スルホン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.40 (18H, s), 2.47 (3H), 4.96 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.72 (1H, q, J=4.6Hz), 7.77 (2H, s), 8.02 (1H, d, J=7.9), 8.09 (1H, brs), 8.17 (1H, dd, J=7.9, 1.2Hz), 8.75 (1H, s), 10.14 (1H, brs).

実施例 221

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2,5-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.42 (18H, s), 1.48 (3H, d, J=7.0Hz), 2.67 (3H, s), 5.00 (1H, q, J=7.0Hz), 5.4 (1H, d, J=18.4Hz), 5.6 (1H, d, J=18.4Hz), 7.73 (1H, d, J=8.0Hz), 7.79 (2H, s), 8.05 (1H, s), 8.18

(1H, d, J=8.0Hz), 9.45 (1H, s), 9.93 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 408.2 (MH⁺)

実施例 222

- 5 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-2-メトキシ-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (18H, s), 3.33 (3H, s), 4.77 (1H, br), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.39 (1H, brs), 7.61 (1H, brs), 7.73-7.83 (2H, m), 7.86 (2H, s), 8.27 (1H, s).

10 実施例 223

{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-メトキシ-酢酸ヒドラジド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.41 (18H, s), 4.35 (1H, br), 4.84 (3H, s), 4.86 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.76 (4H, s), 8.27 (1H, s).

実施例 224

1-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(2-メトキシ-エチル)-フェニル]-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.39 (9H, s), 2.67 (3H, s), 2.94 (2H, t, J=6.8Hz), 3.27 (3H, s), 3.55 (2H, t, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.46-5.52 (2H, m), 7.65-7.74 (3H, m), 8.15 (1H, d, J=8.0Hz), 9.40 (1H, s), 9.46-9.56 (1H, m), 9.93 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 396.1 (MH⁺)

25 実施例 225

3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ

[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-安息香酸 メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (9H, s), 2. 67 (3H, s), 3. 98 (3H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 58-5. 69 (1H, m), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 05 (1H, s), 8. 17 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 38 (1H, s), 9. 99 (1H, s), 12. 07 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 396. 0 (MH⁺)

実施例 226

2-{2-[3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-1-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 81 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 13 (6H, s), 4. 19 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 79 (1H, s), 7. 94 (2H, s), 8. 04 (1H, s), 8. 25 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 531. 2 (MH⁺)

15 実施例 227

2-{2-[3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 81 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 13 (6H, s), 4. 17 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 80 (1H, s), 7. 92 (1H, s), 8. 19 (1H, br), 8. 56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 531. 2 (MH⁺)

実施例 228

25 2-{2-[3-(アセチル-メチル-アミノ)-5-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル

ボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 12 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 10 (3H, s), 4. 18 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 47 (2H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 7. 53 (1H, s) 7. 82 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 54 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

実施例 229

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[6-(1-ヒドロキシ-プロピル)-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 94 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 77-1. 84 (2H, m), 4. 74 (1H, t, J=6. 8Hz), 4. 89 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 67-7. 78 (2H, m), 7. 79 (1H, d, J=7. 6Hz), 7. 93 (2H, s), 8. 13 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 439. 2 (MH⁺) 3

実施例 230

2-{6-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-イル}-2-メトキシ-プロピオンアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 41 (18H, s), 1. 81 (3H, s), 3. 16 (3H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 63 (2H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 78 (2H, s), 7. 83 (1H, d, J=7. 2Hz), 8. 08 (1H, s), 8. 27 (1H, d, J=7. 2Hz), 9. 72 (1H, br), 9. 78 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 481. 1 (MH⁺)

実施例 231

N-{3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-N-メチル-アセトアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 11 (3H, s), 2. 67 (3H, s), 3. 10 (3H, s), 4. 48 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 55 (2

H, s) 7.71 (1H, d, J=8.0Hz), 7.82 (1H, s), 7.92 (1H, s), 8.15 (1H, d, J=8.0Hz), 9.58 (1H, s), 9.95 (1H, s).

実施例 232

5 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.39 (3H, t, J=6.9Hz), 1.40 (18H, s), 4.26 (2H, q, J=6.9Hz), 4.91 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.55 (1H, t, J=8.0Hz), 7.77 (2H, s), 8.03 (1H, d, J=8.0Hz), 8.08 (1H, s), 9.22 (1H, s), 9.90 (1H, brs).

10 MS: m/e (ESI) 441.2 (MH⁺)

実施例 233

{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-エチル-カルバミン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.10 (3H, t, J=6.8Hz), 1.42 (18H, s), 3.62 (3H, s), 3.70 (2H, q, J=6.8Hz), 4.86 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.72 (1H, d, J=8.4Hz), 7.78 (2H, s), 7.79 (1H, d, J=8.4Hz), 8.16 (1H, s).

実施例 234

20 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(6or7-ヒドロキシメチル-1-イミノ-1,3,6,7-テトラヒドロ-5,8-ジオキサ-2-アザ-シクロペンタ[b]ナフタレン-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

3.66 (2H, brs), 4.05-4.16 (2H, m), 4.45 (1H, m), 4.68 (2H, s), 5.15 (1H, t, J=5.0Hz), 5.56 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.26 (1H, s), 7.75 (2H, s), 7.77 (1H, s).

25 実施例 235

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ

-6-メチル-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

2. 29 (3H, s), 2. 86 (3H, d, J=5. 0Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 80 (2H, s), 7. 41 (1H, s), 7. 81 (2H, s), 7. 86 (1H, s).

実施例 236

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-6-(1-メトキシ-プロピル)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 90 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 50 (18H, s), 1. 61-1. 75 (2H, m), 3. 23 (3H, s), 4. 25 (1H, t, J=7. 6Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 92 (2H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 70 (1H, d, J=8. 0 Hz), 7. 98 (2H, s), 8. 70 (2H, brs).

実施例 237

N-(2-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-エチル)-N-メチル-アセトアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 398 (9H, s), 2. 019 (3H, s), 2. 482 (3H, s), 2. 84-2. 92 (1H, m), 2. 96-3. 02 (1H, m), 3. 014 (3H, s), 3. 34-3. 42 (2H, m), 4. 852 (2H, s), 5. 529 (2H, s), 7. 64-7. 78 (3H, m), 8. 155 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 50-9. 60 (2H, m), 9. 90-9. 99 (2H, m).

実施例 238

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-エトキシ-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 42 (18H, s), 4. 48 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 54 (2H, s),

7. 24 (1H, d, J=8.8Hz), 7.77 (2H, s), 8.13 (1H, d, J=8.8Hz), 9.63 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 424.1 (MH⁺)

実施例 239

5 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 ジメチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.15 (3H, t, J=7.0Hz), 1.40 (18H, s), 2.78 (3H, s), 3.00 (3H, s), 4.22 (2H, q, J=7.0Hz),
10 4.82 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.50 (1H, s), 7.77 (2H, s), 8.02 (1H, s), 8.08 (1H, brs), 9.67 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 494.2 (MH⁺)

実施例 240

15 3-第3ブチル-N-エチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-N-メチル-ベンゼンスルホンアミド; 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.09 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 2.63 (3H, s), 2.87 (3H, s), 3.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4
20 .86 (2H, s), 6.24 (2H, s), 7.44 (1H, d, J=8.2Hz), 7.82 (1H, d, J=8.2Hz), 8.11 (1H, s), 8.16 (1H, s), 10.08 (1H, s), 11.98 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 459.1 (MH⁺)

実施例 241

25 3-{6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-2-メチル-アクリル酸エチルエステル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.27 (3H, t, J=6.8Hz), 1.41 (18H, s), 2.34 (3H, s), 4.23 (2H, q, J=6.8Hz), 4.88 (2H, s),

5. 52 (2H, s), 7. 69 (1H, s), 7. 73 (2H, s), 7. 99 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 28 (1H, d, J=8. 4Hz).

MS:m/e (ESI) 492. 3 (MH⁺)

実施例 242

5 2-(2-{3-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-5-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 12 (3H, s), 2. 81 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 09 (3H, s), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 47 (2H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 81 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 7. 94 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 21-8. 25 (1H, m).

実施例 243

15 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 74 (2H, s), 7. 76 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 51 (1H, br), 8. 54 (1H, d, J=5. 2Hz).

実施例 244

20 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-ヒドロキシ-エチル)-アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 5Hz), 3. 38 (2H, dt, J=6. 2, 6. 1Hz), 3. 55 (2H, dt, J=6. 2, 6. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 5Hz), 4. 83 (1H, t, J=6. 1Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 35 (1H, t, J=6. 0Hz), 8. 67 (1H, s), 9. 84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 510. 3 (MH⁺)

実施例 245

6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸 ジメチルアミド;臭化水素酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

2.94 (3H, s), 3.05 (3H, s), 4.94 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.75 (2H, s), 7.96 (1H, d, J=10Hz), 8.38 (1H, d, J=10Hz).

実施例 246

10 1-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピロリジン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.380 (9H, s), 1.93-2.03 (2H, m), 2.34-2.40 (2H, m), 2.672 (3H, s), 3.500 (2H, t, J=7.2 Hz, 2H), 4.426 (2H, s), 4.865 (2H, s), 5.570 (2H, s), 7.709 (2H, d, J=8.0Hz), 7.812 (2H, s), 8.164 (1H, d, J=7.2Hz), 9.951 (1H, s), 10.674 (1H, s).

実施例 247

N-(1-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-エチル)-アセトアミド;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.388 (9H, s), 1.473 (3H, d, J=6.8Hz, 3H), 1.880 (2H, m), 2.673 (3H, s), 4.863 (2H, s), 5.08-5.17 (1H, m), 5.46-5.65 (2H, m), 7.712 (1H, d, J=8.0Hz), 7.760 (1H, s), 7.813 (1H, s), 8.169 (1H, d, J=8.0Hz), 8.948 (1H, d, J=7.6Hz).

実施例 248

25 N-(1-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-エチル)-N-メチル-アセト

アミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 362 (9H, s), 1. 577 (3H, d, J=7. 2Hz), 2. 095 (3H, s), 2. 673 (3H, s), 2. 895 (3H, s), 4. 86
6 (2H, s), 5. 54-5. 76 (3H, m), 7. 711 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 806 (1H, s), 7. 924 (1H, s), 8. 1
5 63 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 577 (1H, s), 9. 952 (1H, s), 11. 076 (1H, s).

実施例 249

N-{3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロ
ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-N-メチル-アセ
トアミド;塩酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32-1. 45 (12H, m), 2. 11 (3H, s), 2. 31 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 11 (3H, s), 3. 90-4. 20 (2
HandH20), 4. 78 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 81 (1H, s), 7. 93 (1H, s), 9. 61 (1H,
s), 9. 85 (1H, s), 11. 28 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 481. 2 (MH⁺)

15 実施例 250

N-{3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロ
ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-N-メチル-メタ
ンスルフォンアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 34-1. 42 (12H, m), 2. 32 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 15 (6H, sX2), 3. 99 (2H, q, J=6. 8Hz), 4
. 83 (1H, s), 5. 50 (1H, s), 7. 81 (1H, s), 7. 96 (1H, s), 9. 42 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs), 10.
03 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 503. 2 (MH⁺)

実施例 251

25 1-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-2-オン;臭化水素酸

塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (9H, s), 2. 11-2. 21 (2H, m), 2. 41-2. 46 (2H, m), 2. 69 (3H, s), 3. 65-3. 71 (2H, m), 4, 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 72 (1H, d, J=8Hz), 7. 74 (1H, s), 7. 78 (1H, s), 8. 17 (1H, d, J=8 Hz).

5

実施例 252

1-(3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペリジン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10

1. 373 (9H, s), 1. 64-1. 78 (4H, m), 2. 34-2. 38 (2H, m), 2. 674 (3H, s), 3. 43-3. 50 (2H, m), 4. 483 (2H, s), 4. 863 (2H, s), 5. 541 (2H, s), 7. 712 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 822 (1H, d, J=2. 0 Hz), 7. 887 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 164 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 940 (1H, s).

実施例 253

15

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-ジメチルアミノメチル-3-エトキシ-7-イミノ-4-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20

1. 25 (18H, s), 1. 37 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 19 (6H, s), 2. 26 (3H, s), 3. 58 (2H, s), 4. 00 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 55 (2H, brs), 4. 88-4. 92 (2H, m), 7. 41 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 495. 3 (MH⁺)

実施例 254

25

[2-(2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボニル}-アミノ)-エチル]-カルバミン酸 第3ブチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (9H, s), 1. 40 (18H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 3. 08-3. 40 (2H, m), 3. 60-3. 78 (2H, m)
) 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 6. 85-6. 94 (1H, m), 7. 55 (1H, s), 7. 7
 5 (2H, s), 8. 29 (1H, t, J=5. 2Hz), 8. 59 (1H, s), 9. 83 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 609. 3 (MH⁺)

5 実施例 255

2-[2-(3, 5-ジ-第3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキ
 シ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-アミノ-エチ
 ル)-アミド; 2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 40 (18H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 96 (2H, brt, J=6. 4Hz), 3. 56 (2H, brq, J=6. 4Hz)
 , 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 77 (2H,
 s), 8. 04 (3H, brs), 8. 47 (1H, t, J=5. 6Hz), 8. 65 (1H, s).

実施例 256

15 ({2-[2-(3, 5-ジ-第3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エト
 キシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボニル}-アミノ)-酢酸;
 トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 40 (18H, s), 1. 45 (3H, t, J=7. 0Hz), 4. 05 (2H, d, J=5. 4Hz), 4. 33 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 8
 5 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 59 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 07 (2H, s), 8. 61 (1H, t, J=5. 4Hz), 8
 . 73 (1H, s), 9. 15 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 524. 2 (MH⁺)

実施例 257

25 2-[2-(3, 5-ジ-第3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキ
 シ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-アセチルアミ
 ノ-エチル)-アミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 18-3. 37 (4H, m), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 7. 96 (1H, t, J=5. 5Hz), 8. 07 (1H, brs), 8. 31 (1H, t, J=5. 1Hz), 8. 60 (1H, s), 9. 13 (1H, brs), 9. 82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 551. 3 (MH⁺)

5 実施例 258

2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2, 3, 6, 7-テトラヒドロ-1H-5, 8-ジオキサ-2-アザ-シクロペンタ[b]ナフタレン-6-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 27 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (18H, s), 4. 25 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 36-5. 15 (3H, m), 7. 30 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 7. 91 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 509. 2 (MH⁺)

実施例 259

15 {3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-メチルカルバミン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (9H, s), 2. 67 (3H, s), 3. 40 (3H, s), 3. 79 (3H, s), 4. 88 (2H, s), 5. 60 (2H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=8Hz), 7. 80 (1H, s), 7. 15 (1H, d, J=8Hz).

20 実施例 260

2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-1-イミノ-6-メチル-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 2. 42 (3H, s), 2. 78 (3H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 40 (1H, d, J=6. 0Hz).

実施例 261

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-1-イミノ-6-メチル-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-メトキシ-エチル)-アミド;臭化水素酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

2.42 (3H, s), 3.26 (3H, s), 3.43 (4H, m), 4.82 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.66 (1H, s), 7.76 (2H, s), 8.05 (1H, s), 8.48 (1H, t, J=6.0Hz).

実施例 262

10 2-{2-[3-(1-アセチルアミノ-エチル)-5-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=6.8Hz), 1.46 (3H, d, J=6.4Hz), 1.86 (3H, s), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.06-5.13 (1H, m), 5.36-5.51 (2H, m), 7.52 (1H, s), 7.74 (1H, s), 7.77 (1H, s), 8.19 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 509.2 (MH⁺)

実施例 263

20 N-[2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-(2-メトキシ-エチル)-ベンジル]-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

2.11 (3H, s), 2.68 (3H, s), 2.87 (2H, t, J=6.8Hz), 3.06 (3H, s), 3.22 (3H, s), 3.53 (2H, t, J=6.8Hz), 4.48 (2H, s), 4.87 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.71 (1H, d, J=8.2Hz), 7.78 (1H, s), 7.82 (1H, s), 8.17 (1H, d, J=8.2Hz).

25 MS:m/e (ESI) 425.1 (MH⁺)

実施例 264

{2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-カルバミン酸メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.38-1.42 (21H, m), 3.70 (3H, s), 4.19 (2H, q, J=6.8Hz), 4.75 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.42 (1H, s), 7.77 (2H, s), 8.50 (1H, s), 8.81 (1H, s), 9.07 (1H, brs), 9.79 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 496.2 (MH⁺)

実施例 265

- 10 {2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-エチル-カルバミン酸メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.05 (3H, t, J=7.2Hz), 1.33 (3H, t, J=7.2Hz), 1.42 (18H, s), 3.26 (3H, s), 3.43-3.51 (2H, m), 4.18 (2H, q, J=7.2Hz), 4.18 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.50 (1H, s), 7.77 (2H, s), 8.04 (1H, s), 9.11 (1H, brs), 9.64 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 542.2 (MH⁺)

実施例 266

- 20 6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸エチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.19 (3H, t, J=10Hz), 3.42 (2H, q, J=10Hz), 4.99 (2H, s), 5.38 (2H, s), 7.78 (2H, s), 8.35 (1H, d, J=10Hz), 8.43 (1H, J=10Hz, 1H), 8.83 (1H, t, J=10Hz).

実施例 267

- 25 3-{6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-2-メチル-アクリルアミ

ド 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 2. 33 (3H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 61 (2H, s), 7. 27 (1H, brs), 7. 35 (1H, br), 7. 68 (1H, brs), 7. 78 (2H, s), 7. 86 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 27 (1H, d, =8. 4Hz), 9. 71 (1H, br).

5 MS:m/e (ESI) 463. 1 (MH⁺)

実施例 268

3-{6-[2-(3, 5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-2-イル}-2-メチル-プロピオンアミド; 臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 09 (3H, d, J=6. 4Hz), 1. 42 (18H, s), 2. 83-2. 89 (2H, m), 3. 14-3. 20 (1H, m), 4. 86 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 6. 75 (1H, s), 7. 29 (1H, s), 7. 66 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 07 (1H, br), 8. 17 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 47 (1H, br), 9. 81 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 465. 2 (MH⁺)

15 実施例 269

N-{3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-N-メチル-メタンスルホンアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 409 (9H, s), 2. 678 (3H, s), 2. 737 (3H, s), 3. 027 (3H, s), 4. 382 (2H, s), 4. 866 (2H, s), 5. 552 (2H, s), 7. 710 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 804 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 814 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 163 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 944 (1H, s).

実施例 270

25 {3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-メチルカルバミン酸 ベンジルエステル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 400 (9H, s), 2. 681 (3H, s), 2. 949 (3H, s), 4. 533 (2H, s), 4. 861 (2H, s), 5. 165 (2H, s),
5. 504 (2H, s), 7. 24-7. 42 (5H, m), 7. 716 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 804 (1H, s), 8. 170 (1H, d, J
=8. 0Hz), 9. 952 (1H, s).

5 実施例 271

1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-ニトロ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル
-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 45 (9H, s), 2. 64 (3H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 60 (2H, s), 7. 73 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 07 (1H, d
10 , J=2. 0Hz), 8. 18 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 52 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 52 (1H, s), 10. 02 (1H, s), 1
1. 50 (1H, s).

実施例 272

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-4-メ
チル-2-プロピル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸

15 塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 95 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37-1. 44 (21H, m), 1. 71-1. 82 (2H, m), 2. 32 (3H, s), 2. 83-2. 90
(2H, s), 3. 97 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 08 (1H, s), 9.
41 (1H, brs), 9. 71 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 480. 2 (MH⁺)

実施例 273

N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-4-メチル-2-プロピル-5, 7-ジヒド
ロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-N-メチ
ル-アセトアミド;塩酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 96 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 65-1. 82 (2H, m), 2. 11 (3H

, s), 2.32 (3H, s), 2.81-2.85 (2H, m), 3.11 (3H, s), 3.98 (2H, q, J=6.8Hz), 4.48 (2H, s), 4.84 (2H, s), 5.47-5.56 (2H, m), 7.81 (1H, s), 7.92 (1H, s), 9.46-9.56 (1H, m), 9.72 (1H, brs), 11.29 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 509.2 (MH⁺)

5 実施例 274

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-メトキシ-エチル)-アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.40 (18H, s), 1.42 (3H, t, J=7.3Hz), 3.30 (3H, s), 3.49 (4H, brs), 4.27 (2H, q, J=7.3Hz) 4.84 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.56 (1H, s), 7.76 (2H, s), 8.07 (1H, s), 8.26 (1H, brs) 8.65 (1H, s), 9.06 (1H, brs), 9.85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 524.2 (MH⁺)

実施例 275

15 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (3-メトキシ-プロピル)-アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.40 (18H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 1.74 (1H, tt, J=6.4, 6.3Hz), 3.25 (3H, s), 3.33 (2H, dd, J=6.3, 5.7Hz), 3.61 (2H, t, J=6.4Hz), 4.25 (2H, q, J=7.0Hz), 4.83 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.53 (1H, s), 7.76 (2H, s), 8.07 (1H, brs), 8.25 (1H, t, J=5.7Hz), 8.51 (1H, s), 9.12 (1H, brs), 9.80 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 538.3 (MH⁺)

実施例 276

25 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5-プロピル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.80 (3H, t, J=6.4Hz), 1.42 (18H, s), 1.82-1.94 (2H, m), 2.04-2.14 (2H, m), 2.67 (3H, s), 5.03 (1H, q, J=2.8), 5.35 (1H, d, J=18.8Hz), 5.61 (1H, d, 18.8Hz), 7.72 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.71 (2H, s), 8.16 (1H, d, J=8.0Hz), 9.95 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 436.2 (MH⁺)

実施例 277

2-(2-{3-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-5-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル}-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-ヒドロキシ-エチル)-アミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=7.1Hz), 2.12 (3H, s), 3.10 (3H, s), 3.38 (2H, dt, J=5.4, 5.2 Hz), 3.54 (2H, dt, J=5.4, 4.9Hz), 4.28 (2H, q, J=7.1Hz), 4.48 (2H, s), 4.83 (1H, t, J=4.9Hz), 4.86 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.56 (1H, s), 7.82 (1H, s), 7.90 (1H, s), 8.46 (1H, t, J=5.2Hz), 8.68 (1H, s), 9.87 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 539.2 (MH⁺)

実施例 278

2-{2-[3-(1-アセチルアミノ-エチル)-5-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-ヒドロキシ-エチル)-アミド;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.39 (9H, s), 1.42-1.48 (6H, m), 1.88 (3H, s), 3.38 (2H, dt, J=5.5, 5.2Hz), 3.54 (2H, dt, J=5.4, 4.9Hz), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.83 (1H, t, J=4.9Hz), 4.85 (2H, s), 5.13 (1H, d, q, J=7.0, 6.4Hz), 5.40 (1H, d, J=18.0Hz), 5.50 (1H, d, J=18.0Hz), 7.56 (1H, s), 7.75 (1H, s), 7.79 (1H, s), 8.37 (1H, t, J=5.2Hz), 8.67 (1H, s), 8.90 (1H, d, J=6.4Hz), 9.85 (1H, brs).

25

MS:m/e (ESI) 539.2 (MH⁺)

実施例 279

N-{3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メトキシメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-N-メチル-アセトアミド;塩酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 11 (3H, s), 3. 10 (3H, s), 3. 41 (3H, s), 4. 48 (2H, s), 4. 68 (2H, s), 4. 91 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 82 (1H, s), 7. 85 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7. 91 (1H, s), 8. 29 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 9. 58 (1H, brs), 10. 00 (1H, brs), 11. 29 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 453. 1 (MH $^+$)

10 実施例 280

N-{3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-プロピル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-N-メチル-アセトアミド;塩酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 0. 93 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1. 37 (9H, s), 1. 72-1. 82 (2H, m), 2. 11 (3H, s), 2. 86-2. 93 (2H, m), 3. 10 (3H, s), 4. 48 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 72 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7. 82 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 17 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 9. 60 (1H, brs), 9. 85 (1H, s), 11. 28 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 451. 1 (MH $^+$)

実施例 281

20 2-{2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イルオキシ}-プロパン酸;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1. 41 (18H, s), 1. 53 (3H, d, $J=6, 4\text{Hz}$), 4. 75 (2H, s), 4. 89-4. 98 (1H, m), 5. 45 (2H, s), 7. 16 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7. 22 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 07 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 9. 07 (1H, brs), 9. 76 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 467. 2 (MH⁺)

実施例 282

6-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸 ジエチルアミド; 臭化水素酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 06 (3H, t, J=10Hz), 1. 16 (3H, t, J=10Hz), 3. 20 (2H, q, J=10Hz), 3. 49 (2H, q, J=10Hz), 4. 92 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 74 (2H, s), 7. 90 (1H, d, J=10Hz), 8. 37 (1H, d, J=10Hz).

実施例 283

2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-6-メトキシ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド; 臭化水素酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

2. 81 (3H, d, J=6. 0Hz), 3. 98 (3H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 31 (1H, brs), 8. 59 (1H, s).

15

実施例 284

2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-6-プロポキシ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド; 臭化水素酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 98 (3H, t, J=10Hz), 1. 82 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=6. 0Hz), 4. 20 (2H, t, J=10Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 31 (1H, d, J=6. 0Hz), 8. 59 (1H, s).

実施例 285

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-1, 3, 6, 7-テトラヒドロ-5, 8-ジオキサ-2-アザ-シクロペンタ[b]ナフタレン-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (3H, d, J=7.2Hz), 1. 42 (18H, s), 3. 90-3. 98 (1H, m), 4. 30-4. 44 (2H, m), 4. 69 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 19-7. 27 (1H, m), 7. 68-7. 74 (1H, m), 7. 77 (2H, s), 9. 04 (1H, brs), 9. 64 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 451. 1 (MH⁺)

実施例 286

1-(3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル)-アゼパン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 370 (9H, s), 1. 46-1. 59 (4H, m), 1. 61-1. 7 (2H, m), 2. 54-2. 60 (2H, m), 2. 674 (3H, s), 3. 54-3. 60 (2H, m), 4. 506 (2H, s), 4. 865 (2H, s), 5. 521 (2H, s), 7. 711 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 811 (1H, s), 7. 987 (1H, s), 8. 160 (1H, d, J=8.0Hz), 9. 920 (1H, s).

実施例 287

15 6-クロロ-2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 42 (18H, s), 2. 80 (3H, d, J=4.8Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 04-8. 12 (1H, br), 8. 29 (1H, s), 8. 59 (1H, q, J=4.4Hz), 9. 38 (1H, br), 9. 95 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 470. 1 (MH⁺)

実施例 288

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-5,7-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 49 (18H, s), 3. 91 (3H, s), 3. 99 (3H, s), 4. 74 (2H, s), 5. 87 (1H, brs), 6. 02 (2H, s), 6. 5

2 (1H, d, J=2Hz), 6.64 (1H, d, J=2Hz), 7.46 (1H, brs), 8.00 (2H, s) 10.75 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 439.0 (MH⁺)

実施例 289

5 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (18H, s), 1.41 (3H, t, J=7.5Hz), 4.84 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.69 (1H, brs), 7.77 (2H, s), 8.07 (1H, s), 8.63 (1H, s), 9.15 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

10 MS:m/e (ESI) 466.1 (MH⁺)

実施例 290

1-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メチルアミノメチル-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.401 (9H, s), 2.582 (3H, t, J=4.8Hz), 2.667 (3H, s), 4.289 (3H, s), 4.869 (2H, s), 5.627 (2H, s), 5.739 (1H, s), 7.705 (1H, d, J=8.0Hz), 7.870 (1H, s), 8.15-8.17 (2H, m), 9.188 (1H, s), 9.959 (1H, s), 10.207 (1H, s).

実施例 291

20 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-6-(2-メトキシ-エトキシ)-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

2.84 (3H, d, J=6.0Hz), 3.76 (2H, t, J=10Hz), 4.85 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.56 (1H, s), 7.76 (2H, s), 8.31 (1H, d, J=6.0Hz), 8.59 (1H, s).

25 実施例 292

2-{2-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(2-オキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-フ

エニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 64-1. 75 (4H, m), 2. 33-2. 37 (2H, m), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 44-3. 49 (2H, m), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 48 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 82 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 88 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 20 (1H, br), 9. 83 (1H, br), 11. 55 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 535. 2 (MH⁺)

実施例 293

10 2-[2-(3-第3ブチル-5-エチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 70 (2H, q, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=4. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 70 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 452. 1 (MH⁺)

実施例 294

20 1-(3-第3ブチル-5-エチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 15 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 32-1. 46 (12H, m), 2. 31 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 2. 69 (2H, q, J=7. 6Hz), 3. 99 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 70 (1H, s), 9. 32 (1H, brs), 9. 48 (1H, s), 9. 83 (1H, s).

25 MS:m/e (ESI) 424. 1 (MH⁺)

実施例 295

1-{3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロ
ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-ピペリジン-2-
オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.32-1.44 (12H, m), 1.64-1.78 (4H, m), 2.32 (3H, s), 2.32-2.40 (2H, m), 2.58 (3H, s), 3.
.41-3.50 (2H, m), 3.95-4.02 (2H and AcOEt), 4.48 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.
82 (1H, s), 7.88 (1H, s), 9.41 (1H, brs), 9.85 (1H, brs), 11.56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 507.2 (MH⁺)

実施例 296

- 10 {2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エト
キシ-7-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-カルバミ
ン酸 メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.34 (3H, t, J=7.2Hz), 1.40 (18H, s), 3.72 (3H, s), 4.25 (2H, q, J=7.2Hz), 4.89 (2H, s),
5.50 (2H, s), 7.76 (2H, s), 8.06 (1H, s), 8.47 (1H, s), 9.28 (1H, s), 9.36 (1H, brs), 10.0
7 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 514.1 (MH⁺)

実施例 297

- 20 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(4-イミノ-3a,4,6,6a-テトラ
ヒドロ-1H-ピロロ[3,4-d]イミダゾール-5-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.31 (18H, s), 4.54 (2H, s), 5.20 (2H, s), 6.34 (1H, s), 7.66 (2H, s), 7.97 (1H, s), 9.42 (1H, s), 9.65 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 369.0 (MH⁺)

- 25 実施例 298

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ

-6-イソプロポキシ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 38 (6H, d, J=6.0Hz), 2. 83 (3H, d, J=5.0Hz), 4. 83 (2H, s), 4. 86 (1H, m), 5. 46 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 09 (1H, d, J=5.0Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 79 (1H, brs).

実施例 299

6-シクロプロピルメトキシ-2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 41 (2H, bd, J=8.0Hz), 0. 60 (2H, bd, J=8.0Hz), 2. 85 (3H, d, J=5.0Hz), 4. 15 (2H, d, J=8.0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 09 (1H, d, J=5.0Hz), 8. 55 (1H, s).

実施例 300

15 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-3-メトキシメチル-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 2. 61 (3H, s), 3. 43 (3H, s), 4. 63 (3H, s), 4. 85 (3H, s), 5. 58 (3H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 07 (1H, brs), 8. 15 (1H, s), 9. 49-9. 53 (1H, m), 9. 89-9. 93 (1H, m).

20 実施例 301

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 39 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 28, (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4.8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 70 (1H, s), 8. 17-8. 23 (1H, m), 8. 55

(1H, s).

MS:m/e (ESI) 438. 1 (MH⁺)

実施例 302

5 3-{6-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イ
ミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-2-メトキシ-アクリルア
ミド 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 3. 76 (3H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 6. 71 (1H, s), 7. 65 (1H, br), 7. 75
(2H, s), 7. 98 (1H, br), 8. 27 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 29 (1H, d, J=8. 0Hz).

10 MS:m/e (ESI) 479. 1 (MH⁺)

実施例 303

{2-[2-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-カルバミン酸 メ
チルエステル;臭化水素酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 25-1. 42 (12H, m), 2. 28 (3H, s), 3. 70 (3H, s), 4. 18 (2H, q, J=6. 8), 4. 74 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 41 (1H, s), 7. 69 (2H, s), 8. 50 (1H, s), 9. 07 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 454. 1 (MH⁺)

実施例 304

20 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (18H, s), 3. 08 (6H, s), 4. 70 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 6. 92-6. 97 (2H, m), 7. 79 (2H, s),
7. 95 (1H, d, J=9. 6Hz), 8. 05 (1H, s), 8. 77 (1H, s), 9. 42 (1H, s).

25 実施例 305

1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ

-2, 4-ジメチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1. 39 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 28 (3H, s), 2. 31 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 99 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 70 (2H, s), 9. 35 (1H, s), 9. 40 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 410. 0 (MH⁺)

実施例 306

10 1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 22 (2H, q, J=7. 0 Hz), 4. 77 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 9. 03 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 485. 1 (MH⁺)

15 実施例 307

3-{6-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-イル}-2-メトキシ-アクリルアミド 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 41 (18H, s), 3. 74, 3. 76 (3H, each s), 4. 85, 4. 89 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 6. 02, 6. 70 (1H, each s), 7. 25 (1H, br), 7. 43 (1H, br), 7. 56, 7. 72 (1H, each d, J=8. 0Hz and J=8. 4Hz), 7. 74, 7. 75 (2H, each s).

実施例 308

25 2-[2-(3-ブromo-5-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;

臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 76 (1H, d, J=2. 4Hz), 8. 05 (1H, 2, J=2. 0Hz), 8. 20 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 18 (1H, br), 9. 84 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 504. 1 (MH⁺)

実施例 309

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz) 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 6. 98 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 64-7. 71 (1H, m), 7. 76 (1H, d, J=1. 6, 8. 4Hz), 7. 81 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 18-8. 22 (1H, m), 8. 55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 424. 0 (MH⁺)

実施例 310

2-(2-{3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-[(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-メチル]-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (9H, s), 1. 45 (3H, t, J=7Hz), 2. 75 (3H, s), 2. 85 (3H, d, J=6Hz), 3. 04 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 3. 39 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 81 (1H, s), 7. 82 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=6Hz), 8. 59 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

実施例 311

- 3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (9H, s), 2. 68 (3H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 30 (2H, s), 7. 66 (1H, d, J=1Hz), 7. 70 (1H, d, J=8Hz), 7. 81 (1H, d, J=1Hz), 8. 14 (1H, d, J=1Hz).

実施例 312

- 5 2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-4, 6-ジエトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 1. 47 (3H, t, J=7Hz), 1. 51 (18H, s), 3. 04 (3H, d, J=5Hz), 4. 13 (2H, q, J=7Hz), 4. 38 (2H, q, J=7Hz), 4. 74 (2H, s), 5. 88 (1H, brs), 5. 96 (1H, q, J=5Hz), 6. 08 (2H, s), 6. 72 (1H, s), 7. 52 (2H, brs), 7. 99 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 524. 0 (MH⁺)

実施例 313

- 15 1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(4-イミノ-1-メチル-4, 6-ジヒドロ-1H-ピロロ[3, 4-d]イミダゾール-5-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

3. 79 (3H, s), 4. 71 (2H, s), 5. 38 (2H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 04 (1H, s), 8. 95 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 383. 0 (MH⁺)

- 20 実施例 314

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(6-イミノ-1-メチル-4, 6-ジヒドロ-1H-ピロロ[3, 4-d]イミダゾール-5-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 3. 92 (3H, s), 4. 55 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 05 (1H, brs), 8. 17 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 35 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 383. 0 (MH⁺)

実施例 315

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[7-イミノ-3-(1-メトキシ-エチル)-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル]-エタノン; 臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 38 (3H, d, $J=6.4\text{Hz}$), 1. 42 (18H, s), 2. 68 (3H, s), 3. 22 (3H, s), 4. 74 (1H, q, $J=6.4\text{Hz}$), 4. 86 (2H, brs), 5. 55 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 16 (1H, s).

実施例 316

10 6-エトキシ-2-[2-(7-ヒドロキシ-インダン-4-イル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 413 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 92-2. 02 (2H, m), 2. 749 (2H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 2. 826 (3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 4. 278 (2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 823 (2H, s), 5. 334 (2H, s), 6. 786 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7. 516 (1H, s), 7. 751 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 8. 556 (1H, s).

15 実施例 317

1-(8-第 3 ブチル-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

20 1. 36 (9H, s), 2. 69 (3H, s), 2. 92 (3H, s), 3. 31 (2H, t, $J=4.4\text{Hz}$), 4. 36 (2H, t, $J=4.4\text{Hz}$), 4. 85 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 19 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7. 30 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7. 71 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8. 16 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 9. 75 (2H, s).

実施例 318

25 2-[2-(8-第 3 ブチル-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 92 (3H, s), 3. 33 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 31 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 36 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 18 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 30 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 55 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 18 (1H, s), 9. 83 (1H, s).

実施例 319

1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 2. 69 (3H, s), 2. 71 (3H, s), 2. 97 (2H, t, J=5. 2Hz), 3. 31 (3H, s), 3. 43 (2H, t, J=5. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 68 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 80 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 17 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 18 (1H, s), 9. 47 (1H, s), 9. 91 (1H, s).

実施例 320

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[3-エトキシ-7-イミノ-4-メチル-2-(2-メチル-プロペニル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 1. 99 (3H, s), 2. 10 (1H, d, J=0. 8Hz), 2. 30 (3H, s), 3. 93 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 6. 53 (1H, brs), 7. 78 (2H, s), 9. 48 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 492. 1 (MH⁺)

実施例 321

1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2, 4-ジメチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34-1.43 (12H, m), 2. 31 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 99 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 6. 96 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 76 (1H, dd, J=8. 4and2. 0Hz), 7. 81 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 42 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs), 10. 62 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 396. 0 (MH⁺)

5 実施例 322

N-{3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-N-メチル-メタンスルホンアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 37-1.44 (12H, m), 2. 32 (3H, s), 2. 59 (3H, s), 2. 73 (3H, s), 3. 02 (3H, s), 4. 00 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 38 (2H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 80 (2H, s), 9. 26-9. 50 (2H, m), 9. 84 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 517. 1 (MH⁺)

実施例 323

15 2-(6-クロロ-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 25 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 06 (1H, brs), 8. 33 (1H, s), 9. 17 (1H, brs), 9. 73 (1H, brs).

20 実施例 324

{6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-エチル-カルバミン酸 第3ブチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 19 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (18H, s), 1. 48 (9H, s), 4. 02 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 01 (1H, d, J=8. 6Hz), 8. 19 (1H, d, J=8. 6Hz), 9. 68 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 523. 2 (MH⁺)

実施例 325

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-エチルアミノ-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 17 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (18H, s), 3. 41 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 63 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 6. 84 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 72 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 06 (1H, s), 9. 21 (1H, s), 9. 32 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 423. 1 (MH⁺)

10 実施例 326

6-エトキシ-2-[2-(4-ヒドロキシ-ナフタレン-1-イル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 (2H, s), 6. 98-7. 03 (1H, m), 7. 12-7. 18 (1H, m), 7. 51-7. 56 (3H, m), 7. 59-7. 63 (1H, m), 8. 18-8. 27 (1H, m), 8. 36-8. 45 (1H, m), 8. 57 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 417. 9 (MH⁺)

実施例 327

6-エトキシ-3-イミノ-2-(2-オキソ-2-フェニル-エチル)-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 61 (2H, t, J=7. 6Hz), 7. 74 (1H, t, J=6. 8Hz), 8. 02 (2H, d, J=6. 8Hz), 8. 20 (2H, q, J=6. 8Hz), 8. 57 (1H, s).

25 MS:m/e (ESI) 351. 9 (MH⁺)

実施例 328

6-エトキシ-2-[2-(4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジ
ヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4.4Hz), 4. 28 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 40
5 (2H, s), 6. 93 (2H, d, J=8.8Hz), 7. 52 (1H, s), 7. 89 (2H, d, J=8.8Hz), 8. 19-8. 21 (1H, m),
8. 56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 368. 0 (MH⁺)

実施例 329

3-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
10 ローイソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-プロパン酸 エ
チルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 17 (3H, t, J=7.2Hz) 1. 39 (9H, s) 1. 41 (3H, t, J=7.2Hz) 2. 58 (2H, t, J=6.4Hz) 2. 82 (3H,
d, J=4.8Hz) 2. 96 (2H, t, J=6.4Hz) 4. 06 (2H, q, J=7.2Hz) 4. 28 (2H, q, J=7.2Hz) 4. 82 (2H,
15 s), 7. 52 (1H, s) 7. 70 (1H, s) 7. 72 (1H, s) 8. 18 (1H, q, J=4.8Hz) 8. 54 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 524. 1 (MH⁺)

実施例 330

2-アセチルアミノ-3-{6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オ
20 キソ-エチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-プロ
ピオンアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 1. 86 (3H, s), 3. 09-3. 15 (1H, m), 3. 27-3. 33 (1H, m), 4. 69-4. 73 (1H, m), 4
. 86 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 09 (1H, brs), 7. 38 (1H, brs), 7. 67 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 77 (2
H, s), 8. 16-8. 21 (2H, m).

25 MS:m/e (ESI) 508. 1 (MH⁺)

実施例 331

3-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-プロパン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 17 (3H, t, J=7.2Hz) 1. 38 (9H, s) 2. 58 (2H, t, 6.4Hz) 2. 68 (3H, s) 2. 95 (2H, t, J=6.4Hz) 4. 06 (2H, q, J=7.2Hz) 4. 83 (2H, s) 5. 47 (2H, s) 7. 68-7. 74 (3H, m) 8. 13 (1H, d, J=8.0Hz).
MS:m/e (ESI) 438. 1 (MH⁺)

実施例 332

- 10 2-[2-(3-シクロヘキシル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20-1. 46 (5H, m), 1. 409 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 66-1. 83 (5H, m), 2. 252 (3H, s), 2. 822 (3H, d, J=4.8Hz), 2. 91-3. 01 (1H, m), 4. 276 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 836 (2H, s), 5. 425 (2H, s), 7. 526 (1H, s), 7. 639 (2H, s), 8. 18-8. 21 (1H, m), 8. 551 (1H, s).
- 15

実施例 333

1-(3-シクロヘキシル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 22-1. 48 (5H, m), 1. 68-1. 85 (5H, m), 2. 262 (3H, s), 2. 680 (3H, s), 2. 93-3. 02 (1H, m), 4. 854 (2H, s), 5. 496 (2H, s), 7. 651 (2H, s), 7. 713 (1H, d, J=8.0Hz), 8. 159 (1H, d, J=8.0Hz).

実施例 334

- 25 2-[2-(3-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

ルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 409 (3H, t, J=6.8Hz), 1.47-1.82 (6H, m), 1.93-2.03 (2H, m), 2.252 (3H, s), 2.822 (3H, d, J=4.4Hz), 4.276 (2H, q, J=6.8Hz), 4.834 (2H, s), 5.424 (2H, s), 7.524 (1H, s), 7.644 (1H, s), 7.659 (1H, s), 8.17-8.23 (1H, m), 8.549 (1H, s).

実施例 335

1-(3-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-5-メチルフェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 1.46-1.1.82 (6H, m), 1.93-2.03 (2H, m), 2.252 (3H, s), 2.669 (3H, s), 4.839 (2H, s), 5.479 (2H, s), 7.63-7.68 (2H, m), 7.700 (1H, d, J=8.4Hz), 8.145 (1H, d, J=8.4Hz).

実施例 336

1-(3-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-5-メチルフェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 1.394 (3H, t, J=6.8Hz), 1.47-1.58 (2H, m), 1.60-1.82 (4H, m), 1.94-2.04 (2H, m), 2.250 (3H, s), 2.310 (3H, s), 2.578 (3H, s), 3.988 (2H, q, J=6.8Hz), 4.811 (2H, s), 5.457 (2H, s), 7.645 (1H, s), 7.659 (1H, s).

実施例 337

2-(2-{3-[(2-ベンジルオキシエチル)-メチルアミノ]-5-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル}-2-オキシエチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 1.40 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.71 (3H, s), 2.84 (3H, d, J=4.4Hz), 3.04 (2H, t, J=

5. 2Hz), 3. 55 (2H, t, J=5. 2Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 53 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 20-7. 40 (5H, m), 7. 55 (1H, s), 7. 68 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 80 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 16 (1H, s), 9. 24 (1H, s), 9. 83 (1H, s).

実施例 338

5 2-(2-{3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-[(2-ヒドロキシ-エチル)-メチル-アミノ]-フェニル}-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 69 (3H, s), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 86 (2H, t, J=5. 2Hz), 3. 58 (2H, t, J=5. 2Hz), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 65 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 71 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 00-10. 00 (2H, brs).

実施例 339

15 6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-4-メチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸第3ブチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 37 (3H, t, 6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 1. 58 (9H, s), 2. 37 (3H, s), 4. 08 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 00-8. 12 (1H, m), 9. 42-9. 55 (1H, m), 9. 98 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 538. 3 (MH⁺)

実施例 340

25 6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-4-メチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (3H, t, J=7.2 Hz), 1.42 (18H, s), 2.35 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.2 Hz), 4.89 (2H, s),
5.53 (2H, s), 7.77 (2H, s), 8.02-8.12 (1H, m), 9.42-9.50 (1H, m), 9.99 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 482.2 (MH⁺)

実施例 341

- 5 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-チアゾール-2-イル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

1.43 (18H, s), 4.96 (2H, s), 5.62 (2H, s), 7.79 (2H, s), 8.03 (1H, d, J=3.1 Hz), 8.09 (1H, d, J=3.1 Hz), 8.42 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.54 (1H, d, J=8.1 Hz), 9.90 (1H, brs).

- 10 MS: m/e (ESI) 463.0 (MH⁺)

実施例 342

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-スルホン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

- 15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

1.40 (18H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.47 (3H, brs), 4.35 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.87 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.15 (1H, q, J=4.5 Hz), 7.67 (1H, s), 7.76 (2H, s), 8.06 (1H, brs), 8.73 (1H, s), 9.23 (1H, brs), 9.94 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 516.2 (MH⁺)

- 20 実施例 343

2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

- 25 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8 Hz), 2.83 (3H, d, J=4.8 Hz), 3.93 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8 Hz), 4.85 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.19 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.54 (1H, s), 7.84 (1H, d, J=2

. 4Hz), 7. 93 (1H, dd, J=2. 4, 8. 8Hz), 8. 17-8. 23 (1H, m), 8. 56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 438. 0 (MH⁺)

実施例 344

5 2-[2-(3-第3ブチル-5-クロロ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 74 (1H, s), 7. 93 (1H, s), 8. 18-8. 22 (1H, m), 8. 55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 458. 1 (MH⁺)

実施例 345

15 2-{2-[3-第3ブチル-5-(2-ジメチルカルバモイル-エチル)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 77-2. 90 (4H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 86 (3H, s), 2. 97 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 7. 73 (1H, s), 8. 18 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 8 (1H, brs), 10. 94 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 523. 1 (MH⁺)

実施例 346

25 2-{2-[3-(2-ジメチルカルバモイル-エチル)-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 23 (3H, s), 2. 68 (2H, t, J=6. 4Hz), 2. 80-2. 86 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 85 (3H, s), 2. 96 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 39 (2H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 67 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 8. 19 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 54 (1H, s).

5 実施例 347

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(2-エチルカルバモイル-エチル)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 0. 98 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 48-2. 53 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 82-2. 88 (2H, m), 3. 04-3. 12 (2H, m), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 8. 17-8. 24 (2H, m), 8. 55 (1H, s)

MS:m/e (ESI) 523. 3 (MH⁺)

15 実施例 348

2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-6-メトキシ-5-プロピル-1, 2, 3, 5-テトラヒドロ-イソインドール-4-オン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 0. 97 (3H, t, J=7Hz), 1. 43 (18H, s), 1. 69 (2H, m), 4. 07 (3H, s), 4. 08 (2H, t, J=6Hz), 4. 56 (2H, s), 4. 79 (2H, s), 6. 04 (1H, s), 7. 79 (1H, s), 7. 98 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 468. 0 (MH⁺)

実施例 349

8-第 3 ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-benz

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 2. 84 (3H, d, J=4Hz), 3. 72 (3H, s), 4. 29 (2H, q, J=7Hz)

, 4.34-4.38 (1H, m), 4.55-4.60 (1H, m), 4.85 (2H, s), 5.45 (2H, s), 5.50 (1H, m), 7.43-7.45 (1H, m), 7.51-7.53 (1H, m), 7.54 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4Hz), 8.57 (1H, s).

実施例 350

5 8-第 3 ブチル-6-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン
-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.49 (9H, s), 2.69 (3H, s), 3.71 (3H, s), 4.33-4.38 (1H, m), 4.54-4.60 (1H, m), 4.86 (2H, s), 5.48-5.53 (1H, m), 5.51 (2H, s), 7.45 (2H, s), 7.53 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=8Hz), 8.17 (1H, d, J=8Hz).

10 実施例 351

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[5-エトキシ-1-イミノ-6-(1-
メトキシ-プロピル)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素
酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 0.83 (3H, t, J=7.2Hz), 1.30-1.42 (21H, m), 1.58-1.75 (2H, m), 3.20 (2H, s), 4.18 (2H, q, J=7.2Hz), 4.56 (1H, t, J=5.6Hz), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.40 (1H, s), 7.77 (2H, s), 8.14 (1H, s), 9.08 (1H, brs), 9.72 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 495.3 (MH⁺)

実施例 352

20 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-5,7-
ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

]1.40 (3H, t, J=7.2Hz), 1.41 (18H, s), 4.25 (2H, q, J=7.2Hz), 4.83 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.77 (2H, s), 7.84 (1H, d, J=2.4Hz), 8.55 (1H, d, J=2.4Hz), 9.83 (1H, brs).

25 MS:m/e (ESI) 424.2 (MH⁺)

実施例 353

6-エトキシ-2-[2-(4-ヒドロキシ-3-メチルフェニル)-2-オキソエチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 408 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 184 (3H, s), 2. 822 (3H, d, J=4.8Hz), 4. 274 (2H, q, J=6.8Hz),
4. 836 (2H, s), 5. 403 (2H, s), 6. 942 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 519 (1H, s), 7. 729 (1H, d, J=8.4
Hz), 7. 779 (1H, s), 8. 17-8. 21 (1H, m), 8. 52-8. 56 (1H, m).

実施例 354

2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(4-ヒドロキシ-3-メチルフェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 393 (3H, t, J=6.8Hz),
2. 184 (3H, s), 2. 310 (3H, s), 2. 577 (3H, s), 3. 986 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 819 (2H, s), 5. 44
2 (2H, s), 6. 944 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 734 (1H, dd, J=2.0, 8.4Hz), 7. 781 (1H, s).

実施例 355

- 15 {2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 36-1. 43 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=4.8Hz), 3. 72 (3H, s), 4. 29 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 83 (2
H, s), 5. 01 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 09 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 52 (1H, s), 7. 84-7. 90 (2H, m),
8. 19 (1H, q, J=4.8Hz), 8. 56 (1H, s).

実施例 356

2-(2-{3-[(アセチルメチルアミノ)-メチル]-4-ヒドロキシ-5-メチルフェニル}-2-オキソエチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 411 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 094 (3H, s), 2. 215 (3H, s), 2. 824 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 044 (3H, s), 4. 279 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 482 (2H, s), 4. 849 (2H, s), 5. 418 (2H, s), 6. 942 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 525 (1H, s), 7. 784 (1H, s), 8. 16-8. 22 (1H, m), 8. 558 (1H, s).

実施例 357

- 5 N-{5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-3-メチル-ベンジル}-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 393 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 093 (3H, s), 2. 212 (3H, s), 2. 314 (3H, s), 2. 579 (3H, s), 3. 048 (3H, s), 3. 989 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 483 (2H, s), 4. 840 (2H, s), 5. 491 (2H, s), 7. 801 (1H, s), 7. 790 (1H, s), 9. 836 (1H, s), 10. 792 (1H, s).

実施例 358

- 15 N-{2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-メチル-ベンジル}-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

2. 093 (3H, s), 2. 215 (3H, s), 2. 670 (3H, s), 3. 044 (3H, s), 4. 483 (2H, s), 4. 858 (2H, s), 5. 488 (2H, s), 7. 704 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 790 (1H, s), 8. 150 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 359

- 20 N-{2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-メチル-ベンジル}-N-メチル-メタン sulfon アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 2. 226 (3H, s), 2. 657 (3H, s), 2. 699 (3H, s), 2. 968 (3H, s), 4. 264 (2H, s), 4. 803 (2H, s), 5. 402 (2H, s), 7. 664 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 717 (2H, s), 8. 114 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 360

N-{6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イ
ミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-アセトアミド;臭化水素
酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.42 (18H, s), 2.18 (3H, s), 4.83 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.77 (2H, s), 8.22 (1H, d, J=8.2Hz), 8.37 (1H, d, J=8.2Hz), 10.65 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 437.2 (MH⁺)

実施例 361

- 10 {2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル]-アセチル}-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37-1.43 (12H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.25-4.30 (4H, m), 4.81 (2H, s), 5.58 (2H, s), 7.46-7.52 (1H, m), 7.72-7.80 (2H, m), 8.17-8.22 (1H, m), 8.52 (1H, s), 12.07 (1H, brs).

- 15 MS:m/e (ESI) 480.1 (MH⁺)

実施例 362

2-{2-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(2-オキシ-ピロリジン-1-イル)-フェニル]
-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.43 (9H, s), 1.44 (3H, t, J=7Hz), 2.13-2.23 (2H, m), 2.42-2.48 (2H, m), 2.85 (3H, d, J=5Hz), 3.65-3.71 (2H, m), 4.30 (2H, q, J=7Hz), 4.86 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.55 (1H, s), 7.66 (1H, d, J=1Hz), 7.80 (1H, d, J=1Hz), 8.21 (1H, q, J=5Hz), 8.58 (1H, s).

実施例 363

- 25 2-{2-[3-第3ブチル-4-(2,2-ジメチル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチ
ル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチ

ルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 11 (9H, s), 1. 43 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 8. 85 (2H, s), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 22 (1H, d, J=9Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 88 (1H, d, J=2Hz), 7. 92 (1H, dd, J=2Hz, 9Hz), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 59 (s, 1H).

実施例 364

カルバミン酸 3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル エステル;臭化水素酸塩

- 10 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 42 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 57 (2H, s), 4. 86 (1H, s), 5. 47 (2H, s), 4. 55 (1H, s), 7. 82 (2H, s), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 7. 58 (1H, s), 7. 21 (1H, brs), 9. 46 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

実施例 365

- 15 N-{6-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イミノ-2-メチル-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-3-イルメチル}-アセトアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 20 1. 39 (18H, s), 1. 92 (3H, s), 2. 65 (3H, s), 4. 39 (2H, d, J=6. 0Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 69 (2H, s), 7. 98 (1H, s), 8. 52 (1H, t, J=6. 0Hz).

実施例 366

{8-第 3 ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イル}-酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

- 25 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 51 (2H, t, J=4. 4Hz), 3. 66

(3H, s), 4.30 (6H, m), 4.84 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.06 (1H, s), 7.29 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4.4Hz), 8.57 (1H, s), 9.19 (1H, s), 9.81 (1H, s).

実施例 367

5 {8-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸 ベンジル エステル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.38 (9H, s), 1.44 (3H, t, J=6.8Hz), 2.85 (3H, d, J=4.4Hz), 3.53 (2H, t, J=3.6Hz), 4.30 (2H, q, J=6.8Hz), 4.32 (2H, t, J=3.6Hz), 4.38 (2H, s), 4.84 (2H, s), 5.16 (2H, s), 5.39 (2H, s), 7.10 (1H, s), 7.20-7.35 (6H, m) 7.56 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4.4Hz), 8.58 (1H, s), 9.20 (1H, s), 9.83 (1H, s).

実施例 368

15 {8-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.38 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.84 (3H, d, J=4.8Hz), 3.50 (2H, t, J=4.4Hz), 4.14 (2H, s), 4.30 (4H, m), 4.84 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.07 (1H, d, J=1.6Hz), 7.27 (1H, d, J=1.6Hz), 7.53 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.57 (1H, s), 9.22 (1H, s), 9.82 (1H, s), 12.50 (1H, s).

実施例 369

25 {8-第3ブチル-6-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.38 (9H, s), 2.69 (3H, s), 4.12 (2H, s), 4.30 (2H, t, J=4.0Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s)

), 7.07 (1H, s), 7.27 (2H, s), 7.71 (1H, d, J=7.6Hz), 8.15 (1H, d, J=7.6Hz), 9.85 (1H, s)

実施例 370

5 {4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-エチルフェノキシ}-酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.18 (t, 3H, J=7.2Hz) 1.42 (t, 3H, J=7.2Hz) 2.70 (q, 2H, J=7.2Hz) 2.82 (d, 3H, J=4.8Hz)
3.71 (s, 3H) 4.29 (q, 2H, J=7.2Hz) 4.86 (s, 2H) 5.00 (s, 2H) 5.43 (s, 2H) 7.08 (d, 1H, J=8.0Hz)
10 7.52 (s, 1H) 7.78~7.87 (m, 2H) 8.18 (q, 1H, J=4.8Hz) 8.57 (s, 1H).

実施例 371

15 6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキシ-2-(3,4,5-トリメトキシフェニル)-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.76 (3H, s), 3.87 (6H, s), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz),
4.87 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.32 (2H, s), 7.54 (1H, s), 8.17-8.23 (1H, m), 8.56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 442.2 (MH⁺)

20 実施例 372

1-(3,5-ジ第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-d]ピリミジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (18H, s), 2.84 (3H, s), 4.96 (2H, s), 5.59 (2H, s), 7.76 (2H, s), 9.26 (1H, s).

25 MS:m/e (ESI) 395.2 (MH⁺)

実施例 373

6-エトキシ-2-[2-(4-ヒドロキシ-3-イソプロピル-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 193 (6H, d, J=6.8Hz), 1. 410 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 823 (3H, d, J=4.8Hz), 3. 20-3. 30 (1H, m), 4. 278 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 839 (2H, s), 5. 412 (2H, s), 6. 950 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 523 (1H, s), , 7. 735 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 779 (1H, s), 8. 198 (1H, d, J=4.8Hz), 8. 552 (1H, s)

実施例 374

- 10 2-[2-(3-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 409 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 49-1. 84 (6H, m), 1. 92-2. 03 (2H, m), 2. 821 (3H, d, J=4.8Hz), 4. 276 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 835 (2H, s), 5. 413 (2H, s), 6. 944 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 522 (1H, s), 7. 727 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 785 (1H, s) 8. 18-8. 21 (1H, m), 8. 552 (1H, s).

実施例 375

- 20 N-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 36 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 11 (3H, s), 3. 10 (3H, s), 4. 16 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 48 (2H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 22 (1H, d, J=8.8Hz), 7. 32 (1H, s), 7. 82 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 09 (1H, d, J=8.8Hz), 9. 10 (1H, s), 9. 72 (1H, s), 11. 27 (1H, s).

実施例 376

6-エトキシ-2-[2-(3-エチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミ

ノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 149 (3H, t, J=7.6Hz), 1.407 (3H, t, 6.8Hz), 2.597 (3H, q, J=7.6Hz), 2.820 (3H, d, J=4.8Hz), 4.273 (2H, q, J=6.8Hz), 4.838 (2H, s), 5.406 (2H, s) 6.946 (1H, d, J=8.4Hz), 7.519 (1H, s), 7.70-7.78 (2H, m), 8.16-8.23 (1H, m), 8.549 (1H, s).

実施例 377

2-[2-(3-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.415 (3H, t, J=6.8Hz), 1.41-1.83 (6H, m), 1.92-2.03 (2H, m), 2.249 (3H, s), 4.273 (2H, q, J=6.8Hz), 4.834 (2H, s), 5.427 (2H, s), 7.522 (1H, s), 7.642 (1H, s), 7.657 (1H, s), 7.693 (1H, s), 7.756 (1H, s), 8.617 (1H, s).

実施例 378

- 15 N-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-N-メチル-メタンスルホンアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.37 (3H, t, J=6.8Hz), 1.41 (9H, s), 2.73 (3H, s), 3.02 (3H, s), 4.16 (2H, q, J=6.8Hz), 4.37 (2H, s), 4.79 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.21 (1H, dd, J=2.0, 8.8Hz), 7.32 (1H, d, J=2.0Hz), 7.80 (1H, s), 7.81 (1H, s), 8.09 (1H, d, J=8.8Hz), 9.10 (1H, s), 9.72 (1H, s), 12.06 (1H, s).

実施例 379

- 25 {2-第3ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.35-1.44 (15H, m), 4.08 (2H, q, J=7.2Hz), 4.15 (2H, q, J=7.2Hz), 4.72 (2H, s), 4.87 (2H, s), 5.45 (3H, s), 7.07 (1H, d, J=8.8Hz), 7.34 (1H, s), 7.87 (1H, d, J=8.8Hz), 9.13 (1H, s), 9.67 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 467.1 (MH⁺)

5 実施例 380

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-カルバモイルメトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.35-1.44 (12H, m), 2.82 (3H, d, J=5.2Hz), 4.27 (2H, q, J=7.2Hz), 4.66 (2H, s), 4.85 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.03 (1H, d, J=8.8Hz), 7.33-7.45 (2H, m), 7.53 (1H, s), 7.85 (1H, s), 7.89 (1H, d, J=8.8Hz), 8.19 (1H, d, J=0.8Hz), 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 481.2 (MH⁺)

実施例 381

15 6-エトキシ-2-[2-(4-エトキシ-3-メチルカルバモイル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.41 (6H, t, J=7.2Hz), 2.82 (3H, s), 2.83 (3H, s), 4.29 (4H, qq, J=6.8Hz, 7.2Hz), 4.86 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.32 (1H, d, J=8.4), 7.53 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=8.4), 8.13 (1H, s), 8.21 (1H, s), 8.35 (1H, s), 8.56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 453.1 (MH⁺)

実施例 382

25 2-エトキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-N-メチル-ベンズアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 67 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4.4Hz), 4. 29 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 32 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 70 (1H, d, J=8.4Hz), 8. 08 (1H, d, J=8.4Hz), 8. 12-8. 17 (2H, m), 8. 35 (1H, s).

実施例 383

- 5 2-エトキシ-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-N-メチル-ベンズアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 40 (6H, t, J=6.8Hz), 2. 32 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4.4Hz), 4. 01 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 29 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 32 (1H, d, J=8.4Hz), 8. 08 (1H, J=8.4Hz), 8. 13 (1H, d, J=4.4Hz), 8. 35 (1H, s), 9. 50 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).
- 10

実施例 384

2-エトキシ-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-N-メチル-ベンズアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 44 (18H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 70 (1H, dd, J=2.4, 9.6Hz), 7. 77-7. 86 (3H, m), 7. 89 (1H, d, J=9.6Hz), 7. 95 (1H, d, J=2.4Hz), 7. 99 (1H, m), 8. 08 (1H, s), 8. 49 (2H, d, J=3.2Hz), 9. 31 (1H, s), 9. 82 (1H, s).
- 15

実施例 385

- 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-5-(ピリジン-3-イルオキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩
- 20

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 44 (18H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 51 (1H, dd, J=2.4, 8.8Hz), 7. 55 (1H, d, J=2.4Hz), 7. 77-7. 84 (3H, m), 8. 00 (1H, m), 8. 09 (1H, m), 8. 28 (1H, d, J=8.8Hz), 8. 46-8. 53 (2H, m), 9. 24 (1H, s), 9. 22 (1H, s).

25 実施例 386

{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ

[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 第 3 ブチル エステル;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37-1. 42 (12H, m), 1. 43 (9H, s), 2. 32 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 99 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 8
5 3 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 05 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 86 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 90
(1H, dd, J=8. 8and2. 0Hz), 9. 40-9. 47 (1H, m), 9. 82-9. 89 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 510. 3 (MH⁺)

実施例 387

{2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2, 4-ジメチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
10 [3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34-1. 67 (12H, m), 2. 31 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 99 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 4. 8
9 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 07 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 85 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 89 (1H, dd, J=8.
8and2. 0Hz), 9. 40-9. 49 (1H, m), 9. 81-9. 91 (1H, m).

15 MS:m/e (ESI) 454. 2 (MH⁺)

実施例 388

{2-第 3 ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 40 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 85 (2H, s), 4. 88 (2H, s), 5
. 46 (2H, s), 7. 07 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 69 (1H, brs), 7. 76 (1H, brs), 7. 86 (1
H, s), 7. 88 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 63 (1H, s), 9. 20-9. 26 (1H, m), 9. 85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 468. 1 (MH⁺)

実施例 389

25 1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[7-イミノ-2-(2-メチル-2H-
ピラゾール-3-イル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b]ピリジン-6-イル]-エタノン;

臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 4. 24 (3H, s), 4. 96 (2H, s), 5. 62 (2H, s), 6. 99 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 79 (2H, s), 8. 22 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 35 (1H, d, J=8. 0Hz).

5 MS:m/e (ESI) 460. 2 (MH⁺)

実施例 390

2-[2-(3, 5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-7-フルオロ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (18H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 29 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 99 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 29 (1H, s), 8. 36-8. 41 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 498. 2 (MH⁺)

実施例 391

15 {2-第3ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 2. 68 (3H, s), 4. 86 (2H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 08 (1H, d, J=9. 2Hz), 7. 71 (1H, d, J=7. 2Hz), 7. 86 (1H, s), 7. 89 (1H, d, J=9. 2Hz), 8. 15 (1H, d, J=7. 2Hz), 9. 57 (1H, s), 9. 95 (1H, s).

20

MS:m/e (ESI) 394. 0 (MH⁺)

実施例 392

{4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 85 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84

(2H, s), 4.85 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.06 (1H, d, J=8.0Hz), 7.50 (1H, s), 7.53 (1H, s), 7.64 (1H, d, J=7.8Hz), 8.19 (1H, q, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.27 (1H, s), 9.85 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 456.1 (MH⁺)

実施例 393

- 5 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-5-メトキシ-7-メチル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (18H, s), 2.63 (3H, s), 3.85 (3H, s), 4.54 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.01 (1H, d, J=2Hz), 7.17 (1H, d, J=2Hz), 7.76 (2H, s).

- 10 MS:m/e (ESI) 423.0 (MH⁺)

実施例 394

1-{3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-[(2-ヒドロキシ-エチル)-メチル-アミノ]-フェニル}-2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 15 1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (3H, t, J=7.2Hz), 1.40 (9H, s), 2.69 (3H, s), 2.86 (2H, t, J=4.8Hz), 3.58 (2H, t, J=4.8Hz), 4.18 (2H, q, J=7.2Hz), 4.78 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.22 (1H, d, J=8.8Hz), 7.33 (1H, s), 7.65 (1H, s), 7.69 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=8.8Hz).

実施例 395

- 20 2-[2-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-チオクロマン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.38 (6H, s), 1.44 (3H, t, J=7Hz), 1.53 (9H, s), 1.91-1.97 (2H, m), 2.85 (3H, d, J=5Hz), 3.08-3.14 (2H, m), 4.31 (2H, q, J=7Hz), 4.87 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.56 (1H, s), 7.77 (1H, s), 7.94 (1H, s), 8.22 (1H, q, J=5Hz), 8.59 (1H, s).

実施例 396

2-[2-(8-第 3 ブチル-4,4-ジメチル-1-オキソ-チオクロマン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;臭化水素酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37 (3H, s), 1.43 (3H, t, J=7Hz), 1.55 (3H, s), 1.61 (9H, s), 2.80-2.90 (2H, m), 2.85 (3H, d, J=5Hz), 3.07-3.27 (2H, m), 4.61 (2H, q, J=7Hz), 4.89 (2H, s), 5.45-5.68 (2H, m), 7.57 (1H, s), 7.86 (1H, s), 8.13 (1H, s), 8.22 (1H, q, J=5Hz), 8.59 (1H, s).

実施例 397

10 {2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-5-エトキシ-6-メチルカルバモイル-2,3-ジヒドロ-イソインドール-1-イリデン}-カルバ
ミン酸 エチルエステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.37 (3H, t, J=7.2Hz), 1.46 (18H, s), 1.55 (3H, t, J=6.8Hz), 3.01 (3H, t, J=4.8Hz), 4.25 (2H, q, J=7.2Hz), 4.32 (2H, q, J=7.2Hz), 4.63 (2H, s), 5.11 (2H, s), 5.80 (1H, s), 6.98 (1H, s), 7.88 (2H, s), 8.82 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 552.3 (MH⁺)

実施例 398

20 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.37 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=6.8Hz), 2.81 (1H, d, J=4.4Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.80 (2H, s), 5.46 (2H, s), 6.96 (1H, d, J=8.4Hz), 7.77 (1H, d, J=8.0Hz), 7.81 (1H, s), 7.94 (1H, s), 8.01 (1H, s), 8.24 (1H, d, J=4.4Hz).

MS:m/e (ESI) 424.2 (MH⁺)

実施例 399

2-[2-(2-第3ブチル-ピリジン-4-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.37 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=6.8Hz), 2.83 (3H, d, J=4.4Hz), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.89 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.55 (1H, s), 7.71 (1H, d, J=6.4Hz), 7.85 (1H, s), 8.20 (1H, d, J=4.4Hz), 8.57 (1H, s), 8.82 (1H, d, J=5.6Hz), 9.24 (1H, brs), 9.90 (1H, brs).

実施例 400

- 10 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-6-(ピリジン-4-イルオキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.44 (18H, s), 4.93 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.30 (2H, d, J=6.8Hz), 7.76-7.83 (3H, m), 7.96 (1H, d, J=8.4Hz), 8.12 (1H, d, J=2.0Hz), 8.52 (2H, d, J=6.8Hz).

実施例 401

- 15 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-5-(ピリジン-4-イルオキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.44 (18H, s), 4.90 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.31 (2H, d, J=7.2Hz), 7.64 (1H, dd, J=2.0, 8.4Hz), 7.75 (1H, d, J=2.0Hz), 7.80 (2H, s), 8.10 (1H, s), 8.36 (1H, d, J=8.4Hz), 8.51 (2H, d, J=7.2Hz), 9.31 (1H, s), 10.00 (1H, s).

実施例 402

2-{2-[8-第3ブチル-4-(2-ヒドロキシ-エチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.36 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.84 (3H, d, J=4.8Hz), 3.43 (2H, t, J=6.0Hz), 3.50

(2H, t, J=4.0Hz), 3.63 (2H, t, J=6.0Hz), 4.25 (2H, t, J=4.0Hz), 4.29 (2H, q, J=6.8Hz), 4.85 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.22 (2H, s), 7.54 (1H, s), 8.22 (1H, q, J=4.8Hz), 8.57 (1H, s), 9.31 (1H, s), 9.88 (1H, s).

実施例 403

- 5 N-{6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-メタンスルホンアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.42 (18H, s), 3.56 (3H, s), 4.80 (2H, s), 5.59 (2H, s), 7.26 (1H, d, J=8.8Hz), 7.78 (2H, s), 8.08 (1H, s), 8.17 (1H, d, J=8.8Hz), 9.50 (1H, s), 9.65 (1H, s), 11.19 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 473.2 (MH⁺)

実施例 404

- 15 2-[2-(3-シクロペンチル-5-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.21-1.33 (2H, m), 1.52-1.69 (2H, m), 1.74-1.80 (2H, m), 1.93-2.02 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.11-4.13 (1H, m), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.53 (1H, s), 7.65-7.71 (2H, m), 8.19-8.22 (1H, m), 8.56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 454.2 (MH⁺)

実施例 405

- 25 2-[2-(7-第3ブチル-2-ヒドロキシメチルベンゾフラン-5-イル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.42 (3H, t, J=6.8Hz), 1.49 (9H, s), 2.83 (3H, d, J=4.8Hz), 4.29 (2H, q, J=7.2Hz), 4.64

(2H, d, J=6.0Hz), 4.88 (2H, s), 5.85 (2H, d, J=6.0Hz), 6.94 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.77 (1H, s), 8.19-8.23 (1H, m), 8.24 (1H, s), 8.57 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 478.2 (MH⁺)

実施例 406

- 5 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-5-メトキシ-7-メトキシメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.50 (18H, s), 3.64 (3H, s), 3.90 (3H, s), 4.75 (2H, s), 5.34 (1H, s), 6.04 (2H, s), 6.68 (1H, d, J=2Hz), 6.80 (1H, d, J=2Hz), 7.47 (1H, brs), 8.00 (2H, s).

- 10 MS:m/e (ESI) 470.0 (MH⁺)

実施例 407

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-ヒドロキシ-1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.42 (18H, s), 3.84 (3H, s), 4.69 (2H, s), 5.43 (2H, s), 6.55 (1H, s), 6.78 (1H, s), 7.75 (2H, s), 8.04 (1H, s), 8.34 (1H, s), 9.10 (1H, s), 11.78 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 426.0 (MH⁺)

実施例 408

- 20 2-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.32-1.48 (15H, m), 4.09 (2H, q, J=7.2Hz), 4.15 (2H, q, J=7.2Hz), 4.66 (2H, s), 4.73 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.03 (1H, d, J=8.8Hz), 7.35 (1H, s), 7.36-7.44 (2H, m), 7.78 (1H, s), 7.86 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=8.8Hz), 9.01-9.16 (1H, brs), 9.50-9.65 (1H, brs).

- 25 MS:m/e (ESI) 468.2 (MH⁺)

実施例 409

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミ
ド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.41 (9H, s), 1.44 (3H, t, J=7Hz), 2.85 (3H, d, J=5Hz), 3.90 (3H, s), 4.30 (2H, q, J=7Hz),
4.87 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.47 (1H, s), 7.55 (2H, s), 8.21 (1H, q, J=5Hz), 8.58 (1H, s)

実施例 410

- 10 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミ
ノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.42 (18H, s), 2.58 (3H, s), 4.69 (2H, s), 4.86 (2H, s), 5.60 (2H, s), 7.78 (2H, s), 8.05-
8.10 (1H, m), 8.20 (1H, s), 9.44-9.50 (1H, m), 9.85-9.90 (1H, m).

実施例 411

- 15 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[7-イミノ-2-メチル-3-(テト
ラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-
イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.42 (18H, s), 1.30-1.85 (6H, m), 2.63 (3H, s), 3.48-3.55 (1H, m), 3.75-3.82 (1H, m), 4
.68 (1H, d, J=14.4Hz), 4.79 (1H, brs), 4.86 (2H, s), 4.88 (1H, d, J=14.4Hz), 5.54 (2H, s),
7.76 (2H, s), 8.20 (1H, s), 9.85-9.95 (1H, m).

実施例 412

2-(3-アミノメチル-7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン
-6-イル)-1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-エタノン;塩酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.42 (18H, s), 2.74 (3H, s), 4.23-4.30 (2H, m), 4.90 (2H, s), 5.59 (2H, s), 7.78 (2H, s),

8. 09 (1H, s), 8. 25 (1H, brs), 9. 55-9. 64 (1H, m), 9. 95-10. 02 (1H, m).

実施例 413

{6-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イミ
ノ-2-メチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-3-イルメチル}-カルバミ
ン酸 第 3 ブチル エステル;臭化水素酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (27H, s), 2. 64 (3H, s), 4. 28-4. 32 (2H, m), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 55-7. 60 (1
H, m), 7. 72 (2H, s), 7. 97 (1H, s).

実施例 414

10 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-ヒドロキシメチル-7-イミ
ノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素
酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 40 (18H, s), 2. 67 (3H, s), 3. 89 (1H, brs), 4. 08 (1H, d, J=12. 0Hz), 5. 46 (2H, dd, J=18.
4Hz, 18. 4Hz), 7. 70 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 73 (2H, s), 8. 15 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 415

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-カルバモイルメトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭
化水素酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 26-1. 30 (12H, m), 4. 15 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 54 (2H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 33 (2H, s), 6. 9
1 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 24-7. 31 (2H, m), 7. 41 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 7. 78 (1H
, d, J=8. 8Hz), 8. 51 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 467. 1 (MH⁺)

25

実施例 416

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メタンスルフォニルアミノ-フェニル)-2-オキソ-エチ

ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 39-1. 47 (12H, m), 2. 83 (3H, d, J=5. 2Hz), 3. 26 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 51-7. 60 (2H, m), 7. 84-7. 92 (1H, m), 7. 95-8. 03 (1H, m), 8. 16-8. 23 (1H, m), 8. 57 (1H, s), 8. 92 (1H, brs), 9. 21 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 501. 2 (MH⁺)

実施例 417

- 10 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 44 (18H, s), 2. 80 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 94 (6H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 79 (2H, s), 8. 05 (1H, s), 8. 10 (1H, s), 8. 37 (1H, m), 8. 94 (1H, s), 9. 54 (1H, s).

実施例 418

- 15 6-クロロ-2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 41 (18H, s), 2. 81 (3H, d, J=4. 4Hz), 5. 06 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 20 (1H, s), 8. 64-8. 72 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 488. 2 (MH⁺)

実施例 419

- 25 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-6-(1-メチル-ピペリジン-4-イルオキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (9H, s), 1. 85-2. 22 (4H, m), 2. 60 (3H, s), 2. 73-3. 12 (4H, m), 4. 61 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 46 (1H, ddd, J=2. 4, 5. 2, 8. 8Hz), 7. 70 (1H, dd, J=5. 2, 8. 8Hz), 7. 80 (2H, s), 7. 87 (1H, dd, J=2. 4, 5. 2Hz), 8. 09 (1H, s), 9. 25 (1H, s), 9. 76 (1H, s).

5 実施例 420

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-5-(1-メチル-ピペリジン-4-イルオキシ)-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 44 (9H, s), 1. 86 (2H, m), 2. 14 (2H, m), 2. 59 (3H, s), 2. 92 (4H, m), 4. 78 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 29 (1H, dd, J=2. 0, 8. 8Hz), 7. 44 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 79 (2H, s), 8. 11 (1H, d, J=8. 8Hz), 9. 06 (1H, s), 9. 72 (1H, s).

実施例 421

15 6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキシ-2-(5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-ナフタレン-2-イル)-エチル]-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 408 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 73-1. 78 (4H, m), 2. 77-2. 83 (4H, m), 4. 276 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 856 (2H, s), 5. 470 (2H, s), 7. 276 (1H, d, J=7. 6Hz), 7. 526 (1H, s), 7. 716 (1H, s), 8. 17-8. 24 (1H, m), 8. 553 (1H, s).

実施例 422

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(6-エトキシ-3-イミノ-1, 3-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-c] ピリジン-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 35 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 41 (18H, s), 4. 44 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 9. 02 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 424. 3 (MH⁺)

実施例 423

N-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロ
ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-メタンスルホンアミド;臭
5 化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 44 (9H, s), 2. 32 (3H, s), 2. 59 (3H, s), 3. 26 (3H, s), 3. 98 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 57 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 88 (1H, brd, J=8. 0Hz), 8. 00 (1H, brs), 8. 92 (1H, brs), 9. 40-9. 51 (1H, m), 9. 85-9. 94 (1H, m).

10 MS:m/e (ESI) 473. 2 (MH⁺)

実施例 424

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-エトキシ-6-フルオロ-1-
イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 41 (18H, s), 4. 23 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 60 (1H, d, J=7. 0Hz), 7. 75 (2H, s), 8. 04 (1H, d, J=11. 0Hz).

実施例 425

2-[2-(3-シクロペンチル-5-エチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチ
20 ルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 150 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 408 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45-1. 84 (6H, m), 1. 94-2. 04 (2H, m), 2. 662 (2H, q, J=7. 6Hz), 2. 824 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 276 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 835 (2H, s), 5. 438 (2H, s), 7. 523 (1H, s), 7. 628 (1H, s), 7. 670 (1H, s), 8. 17-8. 23 (1H, m), 8. 547 (1H, d, J=0. 8Hz).

実施例 426

N-{6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イ
ミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-N-エチル-アセトアミ
ド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

- 5 1.10(3H, t, J=7.0Hz), 1.34(18H, s), 2.07(3H, s), 3.91(2H, q, J=7.0Hz), 4.81(2H, s),
5.29(2H, s), 7.54(2H, s), 7.85(1H, d, J=8.2Hz), 8.27(1H, d, J=8.2Hz).

MS:m/e (ESI) 465.2 (MH⁺)

実施例 427

- 10 N-{2-第3ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジ
ン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-メタンスルホンアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

- 1.44(9H, s), 2.69(3H, s), 4.88(2H, s), 5.57(2H, s), 7.53-7.58(1H, m), 7.72(1H, d, J=
8.0Hz), 7.82-8.00(2H, m), 8.18(1H, d, J=8.0Hz).

実施例 428

- 15 7-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾフラン-2-カルボン酸 メチルエステ
ル;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

- 20 1.42(3H, t, J=6.8Hz), 1.51(9H, s), 2.83(3H, d, J=4.8Hz), 3.93(3H, s), 4.29(2H, q, J=
6.8Hz), 4.89(2H, s), 5.61(2H, s), 7.55(1H, d, J=1.2Hz), 7.95(1H, d, J=1.2Hz), 7.97(
1H, s), 8.18-8.22(1H, m), 8.44(1H, s), 8.58(1H, s).

MS:m/e (ESI) 506.2 (MH⁺)

実施例 429

- 25 8-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキシシ
ン-2or3-カルボン酸 第3ブチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 43 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 2. 84 (3H, d, J=5Hz), 4. 25-4. 35 (1H, m),
 4. 30 (2H, q,
 J=7Hz), 4. 51-4. 57 (1H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 30-5. 34 (1H, m), 5. 46 (2H, s), 7. 46 (1H, d, J
 5 =3Hz), 7. 52 (1H, d, J=3Hz), 7. 55 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (s,
 1H), 9. 22 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

実施例 430

- 2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-
 エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭
 10 化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 45 (3H, t, J=7Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 47 (1H, s), 7. 55 (2H, s), 7. 71 (1H, s), 7. 78 (1H, s), 8. 64 (1H, s).

実施例 431

- 2-[2-(3-第3ブチル-4-メタンсульフォニルアミノ-フェニル)-2-オキソ-エチ
 ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミ
 15 ド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38-1. 46 (12H, m), 3. 27 (3H, s), 4. 29 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 5
 20 3-7. 60 (2H, m), 7. 68-7. 72 (1H, m), 7. 76-7. 81 (1H, m), 7. 86-7. 91 (1H, m), 8. 00 (1H, s),
 8. 64 (1H, s), 8. 93 (1H, brs), 9. 22 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 487. 2 (MH⁺)

実施例 432

- 1-(3-シクロペンチル-5-エチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミ
 25 ノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸
 塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 151 (3H, t, J=7.6Hz), 1.393 (3H, t, J=6.8Hz), 1.46-1.82 (6H, m), 1.94-2.03 (2H, m),
2.311 (3H, s), 2.579 (3H, s), 2.662 (2H, q, J=7.6Hz), 3.054 (3H, s), 3.988 (2H, q, J=6.8
5 Hz), 4.820 (2H, s), 5.503 (2H, s), 7.630 (1H, d, J=2.0Hz), 7.673 (1H, d, J=2.0Hz), 9.32
4 (1H, s), 9.454 (1H, s).

実施例 433

2-[2-(3-第3ブチル-5-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチ
ルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.392 (9H, s), 1.37-1.43 (3H, m), 1.40-1.84 (6H, m), 1.96-2.06 (2H, m), 2.822 (3H, d, J
=4.4Hz), 4.276 (2H, q, J=6.8Hz), 4.835 (2H, s), 5.473 (2H, s), 7.530 (1H, s), 7.709 (1H
, s), 7.690 (1H, s), 8.18-8.24 (1H, m), 8.545 (1H, s).

実施例 434

15 1-(3-第3ブチル-5-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-
イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.391 (9H, s), 1.37-1.43 (3H, m), 1.40-1.85 (6H, m), 1.96-2.07 (2H, m), 2.311 (3H, s),
20 2.578 (3H, s), 3.987 (2H, q, J=7.6Hz), 4.807 (2H, s), 5.495 (2H, s), 7.683 (1H, s), 7.70
7 (1H, s).

実施例 435

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-エトキシ-6-フルオロ-1-
イミノ-7-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;塩酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 1.41 (18H, s), 4.05 (3H, d, J=3.0Hz), 4.22 (2H, q, J=7.0Hz), 4.7

1 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.24 (1H, d, J=6.0Hz), 7.75 (2H, s), 7.60 (1H, d, J=7.0Hz), 7.75 (2H, s), 8.04 (1H, d, J=11.0Hz).

MS:m/e (ESI) 471.2 (MH⁺)

実施例 436

- 5 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-3-プロピル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 0.92 (3H, t, J=5.0Hz), 1.41 (18H, s), 1.67 (2H, dd, J=5.3, 5.0Hz), 2.77 (2H, t, J=5.3Hz) 4.88 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.78 (2H, s), 8.08 (1H, brs), 8.12 (1H, brs), 8.77 (1H, s), 9.40 (1H, brs), 10.02 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 422.2 (MH⁺)

実施例 437

- 15 2-(2-アミノ-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.41 (18H, s), 4.64 (2H, s), 5.49 (2H, s), 6.53 (2H, s), 6.86 (1H, d, J=8.6Hz), 7.76 (2H, s), 7.78 (1H, d, J=8.6Hz), 9.40 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 395.1 (MH⁺)

実施例 438

- 20 6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-(4-メトキシ-3-トリフルオロメチル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.42 (3H, t, J=7.2Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.02 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.87 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.49 (1H, d, J=8.0Hz), 7.54 (1H, s), 8.17 (1H, s), 8.20-8.22 (1H, m), 8.29 (1H, d, J=8.0Hz), 8.57 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 450. 1 (MH⁺)

実施例 439

2-(2-Biphenyl-3-yl-2-oxo-ethyl)-6-ethoxy-3-imino-2,3-dihydro-1H-isoindol
e-5-carboxylic acid methylamide; hydrobromide

5 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 44 (3H, t, J=7Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 4. 31 (2H, q, J=7Hz), 4. 92 (2H, s), 5. 64 (2H, s),
7. 42-7. 48 (1H, m), 7. 51-7. 58 (3H, m), 7. 71-7. 80 (3H, m), 8. 00-8. 08 (2H, m), 8. 23 (1H,
q, J=5Hz), 8. 27-8. 29 (1H, m), 8. 60 (1H, s).

実施例 440

10 6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキシ-2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-エチ
ル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド; 臭化水素酸
塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 62
15 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 87 (1H, t, J=8. 4Hz), 8. 12 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 19-8. 23 (1H, m),
8. 28 (1H, s), 8. 31 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 57 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 420. 1 (MH⁺)

実施例 441

20 ({3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-メチル-アミ
ノ)-酢酸; 臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 75 (3H, s), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 71 (2H, s), 4
. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 66 (1H, d, J=1. 2Hz), 7.
25 84 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 22 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 22 (1H, s), 9. 85 (1H, s).

実施例 442

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 40 (9H, s), 2. 80 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 94 (6H, s), 3. 89 (3H, s), 4. 76 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 45 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, J=2. 0Hz), 8. 09 (1H, s), 8. 38 (1H, m), 8. 97 (1H, s), 9. 54 (1H, s), 9. 66 (1H, s).

実施例 443

- 10 1-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシフェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 20-1. 50 (12H, m), 2. 31 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 99 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 9. 33-9. 48 (1H, m), 9. 67 (1H, s), 9. 80-9. 92 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 426. 2 (MH⁺)

実施例 444

- 20 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(5-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-1-オキサ-4,6-ジアザ-s-インダセン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 2. 61 (3H, s), 4. 90 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 03 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 40 (1H, s), 10. 04 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 434. 2 (MH⁺)

実施例 445

- 25 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7.0Hz), 4. 10 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 79 (2H, s), 4. 88 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 06 (1H, d, J=8.5Hz), 7. 32 (1H, s), 7. 85 (1H, s), 7. 88 (1H, d, J=8.5Hz).

5 実施例 446

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシカルボニルアミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 33 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 40 (9H, s), 3. 72 (3H, s), 4. 25 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 89 (2H, s), 4. 91 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 07 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 85 (1H, s), 7. 89 (1H, d, J=8.0Hz), 8. 46 (1H, s), 9. 30 (1H, s).

実施例 447

15 6-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 35 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 41 (18H, s), 2. 77 (3H, d, J=4.2Hz), 4. 25 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 76 (2H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 53 (1H, brq, J=4.2Hz), 9. 40 (1H, brs), 9. 95 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481. 2 (MH⁺)

実施例 448

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-ジエチルアミノ-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 13 (6H, t, J=6.8Hz), 1. 42 (18H, s), 3. 60 (4H, q, J=6.8Hz), 4. 65 (2H, s), 5. 50 (2H, s),

7.01 (1H, d, J=8.8Hz), 7.77 (2H, s), 7.84 (1H, d, J=8.8Hz), 9.28 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 451.3 (MH⁺)

実施例 449

- 5 2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-
エトキシ-7-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.32 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.88 (2H, s), 4.29 (2H, q, J=6.8Hz), 4.99 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.46 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.29 (1H, s), 8.36-8.43 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 472.2 (MH⁺)

実施例 450

- 15 {2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素
酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.33 (3H, t, J=7.2Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.29 (2H, q, J=6.8Hz), 4.89 (2H, s), 5.00 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.08 (1H, d, J=8.4Hz), 7.86 (1H, d, J=2.4Hz), 7.89 (1H, dd, J=2.4, 8.4Hz), 8.29 (1H, s), 8.36-8.41 (1H, m), 9.47 (1H, s), 10.04 (1H, s).

- 20 MS:m/e (ESI) 500.2 (MH⁺)

実施例 451

- 25 1-(8-第3ブチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキシン-6-イル)-2-(7-イミノ
-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; compound
with 酢酸 第3ブチル エステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.41 (9H, s), 1.44 (9H, s), 2.68 (3H, s), 4.27-4.32 (1H, m), 4.52-4.57 (1H, m), 4.86 (2H

, s), 5.30-5.35 (1H, m), 5.53 (2H, s), 7.46 (2H, d, J=2Hz), 7.52 (1H, d, J=2Hz), 7.72 (1H, d, J=8Hz), 8.33 (1H, d, J=8Hz).

実施例 452

- 5 {3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (9H, s), 2.69 (3H, s), 3.72 (3H, s), 4.86 (2H, s), 4.93 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.41 (1H, d, J=1Hz), 7.57 (1H, d, J=1Hz), 7.72 (1H, d, J=8Hz), 8.17 (1H, d, J=8Hz).

10 実施例 453

{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.41 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=7Hz), 2.85 (3H, d, J=5Hz), 3.73 (3H, s), 4.30 (2H, q, J=7Hz), 4.86 (2H, s), 4.93 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.42 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.57 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=5Hz), 8.58 (1H, s).

実施例 454

- 20 1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (9H, s), 2.69 (3H, s), 3.90 (3H, s), 4.88 (2H, s), 5.58 (2H, s), 7.47 (1H, d, J=2Hz), 7.55 (1H, d, J=2Hz), 7.73 (1H, d, J=8Hz), 8.18 (1H, d, J=8Hz).

実施例 455

- 25 3-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-プロパン酸 メ

チルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 2. 52 (2H, t, J=8Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 2. 97 (2H, t, J=8Hz), 3. 62 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 7. 73 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

実施例 456

8-第 3 ブチル-6-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシベン-2or3-カルボン酸;トリフルオロ酢酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 43 (9H, s), 2. 69 (3H, s), 4. 31-4. 37 (1H, m), 4. 51-4. 57 (1H, m), 4. 87 (2H, s), 5. 30-5. 35 (1H, m), 5. 52 (2H, s), 7. 45 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 73 (1H, d, J=8Hz), 8. 17 (1H, d, J=8 Hz), 9. 52 (1H, s), 9. 97 (1H, s).

実施例 457

- 15 1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-イミダゾール-1-イルメチル-7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 33 (18H, s), 2. 64 (3H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 26 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 6. 99 (1H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 50 (3H, brs), 7. 77 (1H, s).

実施例 458

6-[2-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 0Hz), 3. 87 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=

7.0Hz), 4.88(2H, s), 5.54(2H, s), 7.44(1H, s), 7.52(1H, s), 8.00(1H, s), 8.52(1H, br q, J=4.0Hz), 9.45(1H, brd, J=8.0Hz), 9.67(1H, s), 9.94(1H, brd, J=8.0Hz).

実施例 459

5 {2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.35(3H, t, J=6.9Hz), 1.39(9H, s), 2.77(3H, d, J=4.0Hz), 4.23(2H, q, J=6.9Hz), 4.83(2H, s), 4.88(2H, s), 5.55(2H, s), 7.05(1H, d, J=7.7Hz), 7.85(1H, s), 7.88(1H, d, J=7.7Hz), 7.98(1H, s), 8.56(1H, brq, J=4.0Hz), 9.95(1H, s).

10 実施例 460

2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-安息香酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.37(9H, s), 1.42(3H, t, J=7.2Hz), 2.83(3H, d, J=4.8Hz), 3.86(3H, s), 4.28(2H, q, J=7.2Hz), 4.87(2H, s), 5.51(2H, s), 7.54(1H, s), 7.55(1H, d, J=8.0Hz), 7.91(1H, d, J=8.0Hz), 8.06(1H, s), 8.20(1H, q, J=4.8Hz), 8.57(1H, s).

MS:m/e (ESI) 466.2 (MH⁺)

実施例 461

20 {2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-5-エトキシ-4-フルオロ-6-メチルカルバモイル-2,3-ジヒドロ-イソインドール-1-イリデン}-カルバミン酸 イソプロペニル エステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.46(3H, t, J=7.2Hz), 1.47(18H, s), 2.07(3H, d, J=0.4Hz), 3.01(3H, d, J=4.4Hz), 4.35(2H, dq, J=1.2, 6.8Hz), 4.73(3H, s), 4.90(1H, s), 5.13(2H, s), 5.83(1H, s), 7.88(2H, s), 8.63(1H, s).

MS:m/e (ESI) 582.3 (MH⁺)

実施例 462

2-[2-(3-第3ブチルフェニル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジ
ヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 322 (9H, s), 1. 405 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 90 (2H, s), 4. 20-4. 32 (2H, m), 4. 869 (2H, s), 5. 533 (2H, s), 7. 45-7. 58 (2H, m), 7. 75-7. 86 (2H, m), 7. 972 (1H, s), 8. 18-8. 22 (1H, m), 8. 547 (1H, d, J=1. 2Hz).

実施例 463

2-[2-(3-第3ブチル-5-エチルフェニル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミ
ノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 215 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 317 (9H, s), 1. 408 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 700 (2H, q, J=7. 6Hz), 2. 821 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 276 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 863 (2H, s), 5. 517 (2H, s), 7. 470 (1H, s), 7. 531 (1H, s), 7. 612 (1H, s), 7. 679 (1H, s), 7. 799 (1H, s), 8. 19-8. 22 (1H, m).

15

実施例 464

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(7-イミノ-2-モルフォリノ
-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 41 (18H, s), 3. 64 (4H, t, J=4. 6Hz), 3. 72 (4H, t, J=4. 6Hz), 4. 70 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 26 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 76 (2H, s), 7. 94 (1H, d, J=8. 8Hz), 9. 45 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 465. 2 (MH⁺)

実施例 465

4-{6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-7-イ
ミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-ピペラジン-1-カルボン
酸 第3ブチル エステル;臭化水素酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (27H, s), 3. 44 (4H, t, J=4. 8Hz), 3. 68 (4H, br), 4. 70 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 27 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 76 (2H, s), 7. 94 (1H, d, J=8. 8Hz), 9. 46 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 564. 4 (MH⁺)

実施例 466

- 5 6-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-2-エトキシ-5-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-3-カルボン酸 メチルアミド; 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 32-1. 48 (12H, m), 2. 80-2. 87 (3H, m), 4. 58 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 25-8. 33 (1H, m), 8. 93 (1H, s), 9. 30-9. 38 (1H, m), 9. 95-10. 02 (1H, m)

MS:m/e (ESI) 481. 2 (MH⁺)

実施例 467

- 15 1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-ピペラジン-1-イル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 42 (18H, s), 3. 19 (4H, br), 3. 93 (4H, t, J=4. 8Hz), 4. 72 (2H, s), 5. 58 (2H, s), 7. 35 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 78 (2H, s), 8. 00 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 07 (1H, s), 9. 36 (2H, br), 9. 51 (1H, s), 9. 60 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 464. 2 (MH⁺)

実施例 468

- 25 2-{2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-2-メチル-プロパン酸 第 3 ブチル エステル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (9H, s) 1. 39 (9H, s) 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz) 1. 65 (6H, s) 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz) 4. 27 (2

H, q, J=7.2Hz) 4.84 (2H, s) 5.43 (2H, s) 6.68 (1H, d, J=8.8Hz) 7.52 (1H, s) 7.86 (1H, d, J=8.8Hz) 7.87 (1H, s) 8.19 (1H, q, J=4.8Hz) 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 566.4 (MH⁺)

実施例 469

- 5 2-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-2-メチル-プロパン酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.34-1.46 (12H, m), 1.66 (6H, s), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.27 (2H, q, J=7.2Hz), 4.84 (2H, s), 5.45 (2H, s), 6.73 (1H, d, J=8.8Hz), 7.53 (1H, s), 7.85 (1H, d, J=8.8Hz), 7.87 (1H, s), 8.19 (1H, q, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.25 (1H, brs), 9.86 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 510.2 (MH⁺)

実施例 470

- 15 酢酸 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-5-エトキシ-4-フルオロ-6-メチルカルバモイル-2,3-ジヒドロ-イソインドール-1-イリデンカルバモイルオキシメチルエステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.47 (3H, t, J=8.2Hz), 1.48 (18H, s), 2.18 (3H, s), 3.02 (3H, d, J=5.2Hz), 4.22 (2H, q, J=8.2Hz), 5.13 (2H, ABq, J=16, 0Hz), 5.86 (1H, s), 5.89 (2H, s), 7.87 (2H, s), 8.46 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 614.3 (MH⁺)

実施例 471

- 25 2,2-ジメチル-プロピオン酸 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-5-エトキシ-4-フルオロ-6-メチルカルバモイル-2,3-ジヒドロ-イソインドール-1-イリデンカルバモイルオキシメチルエステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20, 1. 23 (9H, each

s), 1. 47 (18H, s), 1. 48 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 02 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 41 (2H, q, J=6. 8Hz),

4. 87 (2H, s), 5. 63 (2H, s), 5. 87 (1H, s), 5. 88 (2H, s), 7. 87, 7. 89 (1H, each s).

MS: m/e (ESI) 656. 4 (MH⁺)

5 実施例 472

3-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アクリル酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 34-1. 43 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 67 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 43 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 87 (1H, d, J=12Hz), 7. 92-8. 02 (3H, m), 8. 17-8. 23 (1H, m), 8. 56 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 508. 2 (MH⁺)

実施例 473

15 3-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロパン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 32 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 89 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 62 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 36 (2H, t, J=6. 4Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 19 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 83 (1H, s), 7. 91 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 19 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s).

実施例 474

25 {4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,6-ジメトキシ-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 19 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 85 (6H, s), 4. 14 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 69 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 31 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 16-8. 23 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 39 (1H, brs), 9. 91 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 514. 3 (MH⁺)

実施例 475

{2-第 3 ブチル-4-[2-(1-イミノ-5, 7-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 40 (9H, s), 3. 89 (3H, s), 3. 97 (3H, s), 4. 71 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 6. 75 (1H, s), 6. 91 (1H, s), 7. 07 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 85 (1H, s), 7. 87 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 45 (1H, brs), 9. 08 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 441. 1 (MH⁺)

実施例 476

15 3-{6-[2-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-イル}-2-メチル-アクリルアミド 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 36 (9H, s), 2. 32 (3H, d, J=1. 2Hz), 3. 86 (3H, s), 4. 54 (2H, s), 5. 13 (2H, s), 7. 17-7. 21 (2H, br), 7. 31 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 62 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 06 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 477

25 1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-[7-イミノ-2-メチル-3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル]-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 40-1. 90 (6H, m), 2. 62 (3H, s), 3. 45-3. 55 (1H, m), 3. 74-3. 82 (1H, m), 3. 88 (3H, s), 4. 67 (1H, d, J=14. 0Hz), 4. 76-4. 81 (1H, m), 4. 85 (2H, s), 4. 87 (1H, d, J=14. 0 Hz), 5. 50-5. 53 (2H, m), 7. 45 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 19 (1H, s).

実施例 478

- 5 1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 88 (3H, s), 4. 69 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 45 (1 H, d, J=2. 0Hz), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 20 (1H, s).

実施例 479

(2-第 3 ブチル-4-{2-[7-イミノ-2-メチル-3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル]-アセチル}-フェノキシ)-酢酸 第 3 ブチル エステル;臭化水素酸塩

- 15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 44 (9H, s), 1. 30-1. 89 (6H, m), 2. 63 (3H, s) 3. 48-3. 55 (1H, m), 3. 75-3. 82 (1H, m), 4. 68 (1H, d, J=14. 4Hz), 4. 79 (1H, t, J=1. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 4. 87 (1H, d, J=14 . 4Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 05 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 86 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 90 (1 H, dd, J=8. 98, 2. 2Hz), 8. 20 (1H, s).

- 20 実施例 480

{2-第 3 ブチル-4-[2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 第 3 ブチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 40 (9H, s), 1. 44 (9H, s), 2. 58 (3H, s), 4. 68 (2H, s), 4. 84-4. 91 (2H, m), 4. 86 (2H, s), 5 . 55 (2H, s), 7. 05 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 86 (1H, brs), 7. 89 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 20 (1H, s),

9.53 (1H, d, J=7.2Hz), 9.88 (1H, d, J=7.2Hz).

実施例 481

1-(3-第3ブチル-4-[2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (9H, s), 2.58 (3H, s), 4.69 (2H, s), 4.85-4.93 (2H, m), 4.90 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.08 (1H, d, J=8.8Hz), 7.86 (1H, d, J=2.0Hz), 7.89 (1H, dd, J=8.8, 2.0Hz), 8.20 (1H, s), 9.51 (1H, d, J=8.4Hz), 9.89 (1H, d, J=8.4Hz).

実施例 482

10 1-(3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-{2-[7-イミノ-2-メチル-3-(テトラヒドロピラジン-2-イルオキシメチル)-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル]-アセチル}-ベンジル)-ピペリジン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.38 (9H, s), 1.40-1.80 (10H, m), 2.30-2.40 (2H, m), 3.30-3.40 (2H, m), 3.42-3.50 (2H, m), 4.48 (2H, s), 4.68 (1H, d, J=14.4Hz), 4.77-4.80 (1H, m), 4.88 (1H, d, J=14.4Hz), 4.88 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.83 (1H, d, J=1.6Hz), 7.87 (1H, d, J=1.6Hz), 8.20 (1H, s).

実施例 483

20 1-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペリジン-2-オン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37 (9H, s), 1.65-1.78 (4H, m), 2.30-2.40 (2H, m), 2.58 (3H, s), 3.40-3.50 (2H, m), 4.48 (2H, s), 4.61 (2H, s), 4.87 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.82 (1H, d, J=2.0Hz), 7.88 (1H, d, J=2.0Hz), 8.20 (1H, s), 9.52 (1H, d, J=9.2Hz), 9.88 (1H, d, J=9.2Hz), 11.55 (1H, s).

25 実施例 484

1-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フ

ルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 3. 86 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 20 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 43 (1H, s), 7. 52 (1H, s).

実施例 485

6-[2-(3-第 3 ブチル-4-メタンスルフォニルアミノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (3H, t, J=6. 9Hz), 1. 42 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 0Hz), 3. 26 (3H, s), 4. 25 (2H, q, J=6. 9Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 56 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 88 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 00 (2H, s), 8. 52 (1H, brq, J=4. 0Hz), 8. 94 (1H, brs), 9. 50 (1H, brs), 9. 98 (1H, brs).

15

実施例 486

{4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 28 (6H, d, J=6. 0Hz) 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz) 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz) 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz) 4. 60-4. 69 (1H, m) 4. 85 (4H, s) 5. 44 (2H, s) 7. 05 (1H, d, J=8. 8Hz) 7. 51 (1H, s) 7. 53 (1H, s) 7. 62 (1H, d, J=8. 8Hz) 8. 17-8. 23 (1H, m) 8. 56 (1H, s) 9. 24 (1H, brs) 9. 83 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 483. 9 (MH⁺)

実施例 487

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (3H, t, J=7.6Hz), 1.42 (18H, s), 2.94 (2H, q, J=7.6Hz), 4.85 (2H, s), 5.56 (2H, s),
7.73 (1H, d, J=8.0Hz), 7.77 (2H, s), 8.18 (1H, d, J=8.0Hz), 9.85 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 408.2 (MH⁺)

実施例 488

- 5 2-[2-(4-アセチル-ピペラジン-1-イル)-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル]-1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.46 (18H, s), 2.17 (3H, s), 3.69-3.83 (8H, br), 4.74 (2H, s), 4.85 (2H, s), 7.23 (1H, d, J=8.8Hz), 7.88 (1H, d, J=8.8Hz) 7.89 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 506.3 (MH⁺)

実施例 489

- 15 6-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-2-エトキシ-5-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-3-カルボン酸 メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.33-1.44 (12H, m), 2.80-2.87 (3H, m), 3.88 (3H, s), 4.58 (2H, q, J=6.8Hz), 4.86 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.45 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.23-8.36 (1H, m), 8.93 (1H, s), 9.35-9.44 (1H, m), 9.68 (1H, s), 9.98-10.07 (1H, m).

- 20 MS:m/e (ESI) 455.2 (MH⁺)

実施例 490

- 25 6-[2-(3-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-2-エトキシ-5-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-3-カルボン酸 メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (3H, t, J=7.2Hz), 1.46-1.83 (6H, m), 1.91-2.03 (2H, m), 2.25 (3H, s), 2.78-2.89 (

4H, m), 4.58 (2H, q, J=7.2Hz), 4.85 (2H, s), 5.42 (2H, s), 7.655 (1H, s), 7.664 (1H, s), 8.20-8.40 (1H, m), 8.93 (1H, s), 9.35 (1H, s), 9.37-9.49 (1H, m), 9.95-10.08 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 451.1 (MH⁺)

実施例 491

- 5 {2-第 3 ブチル-4-[2-(2-エトキシ-5-イミノ-3-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.28-1.49 (12H, m), 2.84 (3H, d, J=4.8Hz), 4.58 (2H, q, J=6.8Hz), 4.86 (2H, s), 4.89 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.08 (1H, d, J=8.0Hz), 7.86 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=8.0Hz), 8.25-8.39 (1H, m), 8.93 (1H, s), 9.34-9.45 (1H, m), 9.95-10.05 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 483.1 (MH⁺)

実施例 492

- 15 {2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.48 (3H, s), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.73 (3H, s), 3.84 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.74 (2H, s), 4.85 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.53-7.55 (3H, m), 8.20 (1H, d, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s), 9.20 (1H, brs), 9.85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 526.2 (MH⁺) 6

実施例 493

- 25 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-(2-カルバモイル-エトキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (9H, s), 1. 38-1. 45 (3H, m), 2. 58-2. 65 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 23-4. 35 (4H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 6. 94-7. 02 (1H, m), 7. 18 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 45-7. 56 (2H, m), 7. 83 (1H, s), 7. 91 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 15-8. 25 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 82 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 495. 2 (MH⁺)

実施例 494

3-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロパン酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 34 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 77 (2H, t, J=6. 0Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 32 (2H, t, J=6. 0Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 19 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 84 (1H, s), 7. 91 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 26 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 496. 3 (MH⁺)

15 実施例 495

{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 66 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=5. 2Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 18 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 512. 2 (MH⁺)

実施例 496

25 2-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロパン酸;トリフルオロ

酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 36-1. 48 (12H, m), 1. 59 (3H, d, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 08-5. 18 (1H, m), 5. 44 (2H, s), 6. 95-7. 00 (1H, m), 7. 53 (1H, s), 7. 80-7. 94 (2H, m), 8. 14-8. 26 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 19 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 496. 2 (MH⁺)

実施例 497

2-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酪酸;トリフルオロ酢酸

10 塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 06 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 33-1. 57 (12H, m), 1. 94-2. 11 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 05 (1H, t, J=5. 6Hz), 5. 44 (2H, s), 6. 97 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 78-7. 97 (2H, m), 8. 11-8. 26 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 11-9. 24 (1H, m), 9. 76-9. 85 (1H, m).

実施例 498

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 41 (18H, s), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 75 (2H, s).

実施例 499

1-(8-第 3 ブチル-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=7. 1Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 48 (3H, t, J=7. 1Hz), 3. 23-3. 37 (2H, m), 2. 90 (3H, s), 4. 12 (2H, q, J=7. 1Hz), 4. 22 (2H, q, J=7. 1Hz), 4. 33 (2H, brs), 4. 79 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 16 (1H, s), 7. 27 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 9. 04 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 484. 3 (MH⁺)

5 実施例 500

{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 第3ブチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (3H, t, J=7. 4Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 43 (9H, s), 2. 94 (2H, q, J=7. 4Hz), 4. 85 (4H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 05 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 73 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 86 (1H, d, J=1. 8Hz), 7. 90 (1H, dd, J=8. 4Hz, J=1. 8Hz), 8. 18 (1H, d, J=8. 0Hz).

MS: m/e (ESI) 466. 2 (MH⁺)

実施例 501

15 {2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (3H, t, J=7. 4Hz), 1. 40 (9H, s), 2. 94 (2H, q, J=7. 4Hz), 4. 86 (2H, s), 4. 88 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 08 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 73 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 86 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 90 (1H, dd, J=8. 6Hz, J=1. 6Hz), 8. 18 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 54 (1H, s), 9. 86 (1H, s).

20 MS: m/e (ESI) 410. 1 (MH⁺)

実施例 502

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-イソプロピル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 32 (6H, d, J=6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 3. 18-3. 28 (1H, m), 4. 84 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 75 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 18 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 72 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 422. 2 (MH⁺)

実施例 503

2-[2-(8-第 3 ブチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]ジオキシン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 4. 31 (2H, q, J=7Hz), 4. 32-4. 43 (4H, m), 4. 86 (2H, s), 5. 46 (2H, s,), 7. 44 (1H, s), 7. 47 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

10 実施例 504

2-[2-(3-第 3 ブチル-4, 5-ジメトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 38 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 3. 89 (3H, s), 3. 91 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 55 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=8Hz), 8. 58 (1H, s).

実施例 505

1-(8-第 3 ブチル-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2, 4-ジメチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 33 (3H, s), 2. 60 (3H, s), 2. 93 (3H, s), 4. 01 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 36 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 19 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 29 (1H, d, J=1. 6Hz), 9. 20-10. 00 (2H, brs).

25

実施例 506

3-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アクリル酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39-1. 46 (12H, m) 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz) 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz) 4. 87 (2H, s) 5. 53 (2H, s)
5 6. 35 (1H, d, J=16Hz) 7. 54 (1H, s) 7. 79 (1H, d, J=8. 0Hz) 7. 90 (1H, d, J=8. 0Hz) 7. 99 (1H, s)
8. 17-8. 23 (1H, m) 8. 27 (1H, d, J=16Hz) 8. 57 (1H, s) 9. 26 (1H, brs) 9. 87 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 478. 2 (MH⁺)

実施例 507

10 7-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メチル-ベンゾフラン-3-カルボン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 49 (9H, s), 2. 81 (3H, s), 2. 83 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 62 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 81 (1H, s), 8. 18-8. 24 (1H, m), 8. 47 (1H, s), 8. 57 (1H, s).
15

MS:m/e (ESI) 566. 2 (MH⁺)

実施例 508

20 3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-安息香酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 98 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 12-8. 22 (1H, m), 8. 38 (1H, d, J=2. 4Hz), 8. 56 (1H, s).
25

MS:m/e (ESI) 468. 2 (MH⁺)

実施例 509

3-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-プロパン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 41 (9H, s), 2. 55 (2H, t, J=8.0Hz), 2. 82 (3H, d, J=4.8Hz), 3. 17 (2H, t, J=8.0Hz), 4. 28 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 48 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 81 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 93 (1H, s), 8. 16-8. 24 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 23 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 480. 2 (MH⁺)

10 実施例 510

2-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロパン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 34-1. 47 (12H, m), 1. 59 (3H, d, J=6.4Hz), 2. 31 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 99 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 13 (1H, q, J=6.4Hz), 5. 49 (2H, s), 6. 97 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 86 (1H, s), 7. 88 (1H, d, J=8.4Hz), 9. 36-9. 45 (1H, m), 9. 81-9. 90 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 468. 2 (MH⁺)

実施例 511

- 20 2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン)-1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 03-1. 12 (4H, m), 1. 41 (18H, s), 2. 26-2. 36 (1H, m), 4. 81 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 71 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 76 (2H, s), 8. 09 (1H, d, J=8.0Hz), 9. 63 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 420. 2 (MH⁺)

実施例 512

1-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.39(9H, s), 3.85(3H, s), 3.95(3H, s), 4.81(2H, s), 4.88(2H, s), 5.47(2H, s), 7.07(1H, d, J=8.8Hz), 7.35(1H, s), 7.82-7.90(2H, m).

実施例 513

1-(8-第3ブチル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;塩酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.34(9H, s), 2.90(3H, s), 3.25-3.36(3H, m), 3.86(3H, s), 3.95(3H, s), 4.33(2H, dd, J=5.5, 4.1Hz), 4.79(2H, s), 5.44(2H, s), 7.15(1H, s), 7.26(1H, s), 7.35(1H, s).

実施例 514

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-(ピロリジン-1-イル)-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.41(18H, s), 1.94-2.00(4H, br), 3.45-3.52(4H, br), 4.67(2H, s), 5.50(2H, s), 6.87(1H, d, J=8.8Hz), 7.76(2H, s), 7.86(1H, d, J=8.8Hz), 9.25(2H, s).

20 MS:m/e (ESI) 449.2 (MH⁺)

実施例 515

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[2-(ethyl-メチル-アミノ)-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.10(3H, t, J=7.0Hz), 1.41(18H, s), 3.09(3H, s), 3.67(2H, q, J=7.0Hz), 4.66(2H, s),

5. 50 (2H, s), 7. 04 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 86 (1H, d, J=8. 8Hz), 9. 32 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 437. 2 (MH⁺)

実施例 516

5 2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-安息香酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (9H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 48-7. 56 (2H, m), 7. 89 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 03 (1H, s), 8. 15-8. 23 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 30 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

10 MS:m/e (ESI) 452. 1 (MH⁺)

実施例 517

2-[2-(4-第 3 ブチルフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 32 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 63 (2H, d, J=7. 2Hz), 7. 95 (2H, d, J=7. 2Hz), 8. 18-8. 24 (1H, m), 8. 56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 408. 1 (MH⁺)

実施例 518

20 1-(8-第 3 ブチル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 03-1. 16 (4H, m), 1. 35 (9H, s), 2. 26-2. 37 (1H, m), 2. 91 (3H, s), 4. 34 (2H, brs), 4. 82 (2H, s), 5. 52 (2H, brs), 7. 17 (1H, s), 7. 28 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 42-9. 53 (1H, m), 9. 60-9. 71 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 419.1 (MH⁺)

実施例 519

2-[2-(3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミ
ド;臭化水素酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.34 (6H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.37
(2H, s), 4.85 (2H, s), 5.43 (2H, s), 6.98 (1H, d, J=8.0Hz), 7.53 (1H, s), 7.87 (1H, d, J=8
.0Hz), 7.89 (1H, s), 8.14-8.25 (1H, m), 8.56 (1H, s).

10

MS:m/e (ESI) 422.1 (MH⁺)

実施例 520

2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イ
ル)-1-(3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-エタノン;臭化水素
酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.34 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21
(2H, q, J=6.8Hz), 4.37 (2H, s), 4.79 (2H, s), 5.41 (2H, s), 6.97 (1H, d, J=8.4Hz), 7.33 (1H, s), 7.85 (1H, d, J=8.4Hz), 7.88 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 427.1 (MH⁺)

20

実施例 521

2-(3-クロロ-2-ジエチルアミノ-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン
-6-イル)-1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-エタノン;臭化水素酸
塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25

1.15 (6H, t, J=7.2Hz), 1.42 (18H, s), 3.51 (4H, q, J=7.2Hz), 4.73 (2H, s), 5.54 (2H, s),
7.77 (2H, s), 8.20 (1H, s), 9.51 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 485.2 (MH⁺)

実施例 522

{8-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン
-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;臭化

5 水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 30 (3H, t, J=7.6Hz), 1. 35 (9H, s), 2. 93 (2H, q, J=7.6Hz), 3. 47 (2H, br), 4. 01 (2H, s),
 4. 27 (2H, br), 4. 81 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 06 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=8. 0H
 z), 8. 15 (1H, d, J=8. 0Hz).

10 MS:m/e (ESI) 451.1 (MH⁺)

実施例 523

7-シアノ-2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチ
ル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭
化水素酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (18H, s), 2. 86 (3H, d, J=4.4Hz), 5. 17 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 69 (1H,
 d, J=1.2Hz), 8. 88 (1H, m), 9. 05 (1H, d, J=1.2Hz).

実施例 524

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-
イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素
酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34-146 (21H, m), 3. 87 (3H, s), 4. 22 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 77 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34
 (1H, s), 7. 75 (2H, s), 9. 03 (1H, brs).

25 実施例 525

{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒド

ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 30-1. 48 (12H, m), 3. 86 (3H, s), 4. 22 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 4. 88 (2H, s), 5. 4
9 (2H, s), 7. 07 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 33 (1H, s), 7. 82-7. 90 (2H, m), 9. 08 (1H, brd), 9. 45 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 473. 1 (MH⁺)

実施例 526

2-{3-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-2-メチルプロパン酸 メチルエステル;臭化

水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 388 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 529 (6H, s), 2. 810 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 570 (3H, s), 4. 257 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 852 (2H, s), 5. 475 (2H, s), 7. 487 (1H, s), 7. 54-7. 68 (2H, m), 7. 857 (1H, s), 7. 91 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 239 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 498 (1H, s).

実施例 527

{2-第3 ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (9H, s), 1. 40 (2H, t, J=7. 1Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 7Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 1Hz), 4. 37 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 7. 27 (1H, t, J=8. 0Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 64 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 79 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 20 (1H, brq, J=4. 7Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 40 (1H, brd), 9. 94 (1H, brd).

MS:m/e (ESI) 482. 2 (MH⁺)

実施例 528

{2-第3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=6.9Hz), 1.32-1.46 (12H, m), 4.11 (2H, q, J=6.9Hz), 4.22 (2H, q, J=6.7Hz)
4.38 (2H, s), 4.82 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.27 (1H, t, J=5.2Hz), 7.32 (1H, s), 7.63 (1H,
d, J=5.2Hz), 7.80 (1H, d, J=5.2Hz), 9.11 (1H, brs), 9.45 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 487.2 (MH⁺)

実施例 529

3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-安息香酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.38 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.2Hz), 2.83 (3H, d, J=4.8Hz), 3.88 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=
7.2Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.98 (1H, d, J=2.0Hz), 8.15 (1H, d, J=2
.4Hz), 8.16-8.22 (1H, m), 8.56 (1H, s), 9.19 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 482.3 (MH⁺)

実施例 530

15 3-第3ブチル-2-カルボキシメトキシ-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカル
バモイル-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-安息香酸 メチルエ
ステル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.39 (3H, t, J=7.2Hz), 1.41 (9H, s), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 3.88 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=
7.2Hz), 4.55 (2H, s), 4.85 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.54 (1H, s), 8.04 (1H, d, J=2.4Hz), 8.
16 (1H, d, J=3.0Hz), 8.18-8.23 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.26 (1H, brs), 9.89 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 540.3 (MH⁺)

実施例 531

25 {3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-酢酸;トリ
フルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 88 (3H, s), 3. 96 (2H, d, J=5. 6Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, brs), 5. 50 (2H, brs), 7. 54 (1H, s), 7. 93 (1H, s), 8. 18-8. 22 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 8. 81 (1H, t, J=5. 6Hz), 9. 23 (1H, s), 9. 86 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 539. 3 (MH⁺)

実施例 532

({3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシベンゾイル}-メチル-アミノ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36, 1. 38 (9H, each, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92, 3. 08 (3H, each, s), 3. 78, 3. 88 (3H, each, s), 3. 82, 3. 92 (2H, each, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, brs), 5. 51 (2H, brs), 7. 54 (1H, brs), 7. 74 (1H, brs), 7. 91 (1H, brs), 8. 55 (1H, brs), 8. 18-8. 22 (1H, m), 9. 24 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 553. 4 (MH⁺)

実施例 533

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 67-1. 88 (4H, m), 2. 31 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 13 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 17 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 84 (1H, s), 7. 90 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 24 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs), 12. 05 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 524. 2 (MH⁺)

25 実施例 534

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-

イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.20 (2H, m), 4.18 (2H, q, J=7.2Hz), 4.78 (2H, s), 5.36 (2H, s), 7.12 (1H, d, J=12.0Hz), 7.18 (1H, s), 7.64 (2H, s).

5 MS:m/e (ESI) 441.2 (MH⁺)

実施例 535

{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.82-1.93 (4H, m), 2.83 (3H, d, J=4.8Hz), 3.04-3.18 (4H, m), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.40 (2H, s), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.41 (1H, s), 7.48 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.13-8.25 (1H, m), 8.56 (1H, s), 9.15 (1H, brs), 9.83 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 551.4 (MH⁺)

実施例 536

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.34-1.43 (12H, m), 1.83-1.92 (4H, m), 3.07-3.16 (4H, m), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.46 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 556.2 (MH⁺)

25 実施例 537

{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]

ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1.04-1.14 (4H, m), 1.38 (9H, s), 1.82-1.94 (4H, m), 2.27-2.36 (1H, m), 3.03-3.18 (4H, m), 4.40 (2H, s), 4.82 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.41 (1H, s), 7.48 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.08 (1H, d, J=8.0 Hz).

MS:m/e (ESI) 491.3 (MH⁺)

実施例 538

10 {4-第3ブチル-2-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-インドル-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.25 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.7 Hz), 2.82 (3H, brs), 4.27 (2H, q, J=6.7 Hz), 4.86 (2H, s), 4.91 (2H, s), 5.37 (2H, s), 7.14 (1H, d, J=9.0 Hz), 7.50 (1H, s), 7.69 (1H, brd, J=9.0 Hz), 7.83 (1H, s), 8.20 (1H, brq, J=4.0 Hz), 9.32 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 482.2 (MH⁺)

実施例 539

{4-第3ブチル-2-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドル-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.24-1.32 (12H, m), 1.39 (3H, t, J=6.7 Hz), 4.12 (2H, q, J=6.7 Hz), 4.22 (2H, q, J=6.7 Hz), 4.82 (2H, s), 4.89 (2H, s), 5.37 (2H, s), 7.14 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.31 (1H, s), 7.69 (1H, dd, J=8.3, 2.8 Hz), 7.83 (1H, d, J=2.8 Hz), 9.02 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 487.1 (MH⁺)

実施例 540

25 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[2-エチル-7-イミノ-3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-

イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 30 (3H, t, J=7. 3Hz), 1. 30-1. 80 (6H, m), 1. 42 (18H, s), 2. 93 (2H, q, J=7. 3Hz), 3. 47-3. 55 (1H, m), 3. 75-3. 82 (1H, m), 4. 69 (1H, d, J=13. 6Hz), 4. 78-4. 81 (1H, m), 4. 86 (2H, s), 4. 90 (1H, d, J=13. 6Hz), 5. 55 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 21 (1H, s), 9. 75-9. 82 (1H, m).

実施例 541

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-エチル-3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 04 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 2. 87 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 72 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 07 (1H, brs), 8. 21 (1H, s), 9. 53 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 75 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 542

- 15 3-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-プロパン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 165 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 371 (9H, s), 1. 411 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 67-2. 73 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 96-3. 02 (2H, m), 3. 799 (3H, s), 4. 058 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 278 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 147 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 851 (2H, s), 5. 505 (2H, s), 7. 542 (1H, s), 7. 77 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 838 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 206 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 558 (1H, s).

実施例 543

- 25 3-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-プロパン酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 371 (9H, s), 1. 402 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 630 (2H, t, J=7. 6Hz), 2. 814 (3H, d, J=3. 2Hz),
2. 93-2. 99 (2H, m), 3. 802 (3H, s), 4. 267 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 838 (2H, s), 5. 600 (2H, s),
7. 522 (1H, s), 7. 785 (1H, s), 7. 848 (1H, s), 8. 204 (1H, s), 8. 215 (1H, s), 8. 573 (1H, s),
10. 033 (1H, d, J=8. 4Hz), 12. 262 (1H, s).

実施例 544

2-[2-(8-第 3 ブチル-4-カルバモイルメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 51 (2H, t, J=4. 0Hz), 3. 90 (2H, s), 4. 31 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 34 (2H, t, J=4. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 02 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 12 (1H, s), 7. 27 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 50 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 22 (1H, s), 9. 81 (1H, s).

実施例 545

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ヒドロキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 85 (3H, d, J=5. 0Hz), 3. 90 (3H, s), 4. 29 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 41 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 45 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=5. 0Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 32 (1H, brs), 9. 91 (1H, brs), 10. 03 (1H, s).

実施例 546

- {3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酢酸;トリフルオ

ロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 5 1. 39 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 47 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 3. 98 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 82 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 44 (1H, d, J=2Hz), 7. 56 (1H, s), 7. 58 (1H, d, J=2Hz), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 59 (1H, s), 9. 25 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

実施例 547

2-{2-[3-第3 ブチル-4-(2H-テトラゾール-5-イルメトキシ)-フェニル]-2-オキシノ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;塩酸塩

10 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 32 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 5. 64 (2H, s), 7. 00 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 33-7. 45 (2H, m), 7. 53 (1H, s), 7. 86 (1H, s), 7. 94 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 25 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 506. 2 (MH⁺)

実施例 548

{2-第3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸
エチルエステル;臭化水素酸塩

20 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 24 (3H, t, J=6. 4Hz), 1. 31-1. 50 (12H, m), 1. 78-1. 99 (4H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 02-3. 17 (4H, m), 4. 22-4. 40 (4H, m), 4. 49 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 13-8. 28 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 14 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

25 MS:m/e (ESI) 579. 3 (MH⁺)

実施例 549

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸 エチ
ルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 23 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 29 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 33-1. 48 (12H, m), 1. 82-1. 94 (4H, m), 3
. 04-3. 16 (4H, m), 4. 11 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 15-4. 30 (4H, m), 4. 49 (2H, s), 4. 78 (2H, s),
5. 48 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 48 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 584. 3 (MH⁺)

実施例 550

- 10 2-[2-(3,5-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-フルオロ
-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水
素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 44 (18H, s), 2. 85 (3H, d, J=4.4Hz), 5. 05 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 79 (2H, s), 8. 13 (1H,
dd, J=1.3, 9.5Hz), 8. 69 (1H, d, J=1.3Hz), 8. 77 (1H, m).

実施例 551

{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸;トリ
フルオロ酢酸塩

- 20 ¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 70-2. 08 (4H, m), 2. 88-3. 21 (4H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 39 (2H
, s), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 47 (1H, s), 9. 07 (1H, brs),
9. 29 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 528. 1 (MH⁺)

- 25 実施例 552

{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル)-
酢酸;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 31 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7.2Hz), 3. 50 (2H, t, J=4.4Hz), 4. 13 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 16 (2H, s), 4. 22 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 31 (2H, t, J=4.4Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 06 (1H, d, J=2.0Hz), 7. 26 (1H, d, J=2.0Hz), 7. 33 (1H, s), 9. 02 (1H, s), 9. 35 (1H, s), 12. 71 (1H, s).

実施例 553

10 {8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7.2Hz), 2. 33 (3H, s), 2. 60 (3H, s), 3. 50 (2H, t, J=4.4Hz), 4. 01 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 16 (2H, s), 4. 31 (2H, t, J=4.4Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 07 (1H, d, J=1.6Hz), 7. 28 (1H, d, J=1.6Hz), 9. 45 (1H, s), 9. 84 (1H, s), 12. 71 (1H, s).

実施例 554

2-[2-(8-第3ブチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7.2Hz), 2. 84 (3H, d, J=4.8Hz), 3. 36 (2H, t, J=4.4Hz), 4. 23 (2H, t, J=4.4Hz), 4. 29 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 14 (1H, d, J=2.0Hz), 7. 18 (1H, d, J=2.0Hz), 7. 54 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4.8Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 28 (1H, s), 9. 88 (1H, s).

25 実施例 555

{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル)-
酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.35 (9H, s), 3.48 (2H, brs), 3.86 (2H, s), 3.95 (2H, s), 4.12 (2H, s), 4.28 (2H, brs), 4.78 (2H, s), 5.42 (2H, s), 7.04 (1H, s), 7.24 (1H, s), 7.34 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 500.1 (MH⁺)

実施例 556

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-6-メ
トキシ-5-プロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;塩酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.00 (3H, t, J=7.1Hz), 1.41 (18H, s), 1.75-1.86 (2H, m), 3.87 (3H, s), 4.12 (2H, t, J=6.4Hz), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.75 (2H, s).

実施例 557

{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-5-プロポキシ-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

- 15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.99 (3H, t, J=7.5Hz), 1.38 (9H, s), 1.72-1.86 (2H, m), 3.87 (3H, s), 4.11 (2H, t, J=6.4Hz), 4.78 (2H, s), 4.87 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.07 (1H, d, J=8.1Hz), 7.34 (1H, s), 7.78-7.92 (2H, m), 9.06 (1H, brs).

- 20 実施例 558

2-[2-(3,3-ジメチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-2-オキソ-
エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.30 (6H, s), 1.40 (3H, t, J=7.2Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.27 (2H, q, J=7.2Hz), 4.85 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.03 (1H, d, J=8.0Hz), 7.52 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=8.0Hz), 7.97 (

1H, s), 8.16-8.24 (1H, m), 8.55 (1H, s), 10.90 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 435.0 (MH⁺)

実施例 559

- 5 6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキシ-2-(1,3,3-トリメチル-2-オキシ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.30-1.43 (9H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.19 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=7.2Hz), 4.85 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.20-7.24 (1H, m), 7.52-7.54 (1H, m), 7.98-8.02 (2H, m), 8.17-8.21 (1H, m), 8.56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 449.1 (MH⁺)

実施例 560

- 15 {5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2-オキシ-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.34 (6H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.53 (2H, s), 4.86 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.24 (1H, d, J=8.0Hz), 7.58 (1H, s), 7.97 (1H, d, J=8.0Hz), 8.03 (1H, s), 8.17-8.25 (1H, m), 8.56 (1H, s), 9.25 (1H, brs), 9.85 (1H, brs).

- 20 MS:m/e (ESI) 493.1 (MH⁺)

実施例 561

- 25 2-{3-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-2-メチル-プロパン酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.410 (3H, t, J=6.8Hz), 1.514 (9H, s), 2.823 (3H, d, J=4.8Hz), 4.279 (2H, q, J=6.8Hz), 4.869 (2H, s), 5.525 (2H, s), 7.539 (1H, s), 7.582 (1H, t, J=7.6Hz), 7.716 (1H, d, J=8.4

Hz), 7.913 (1H, d, J=8.4Hz), 7.924 (1H, s), 8.205 (1H, q, J=4.8Hz), 8.563 (1H, s).

実施例 562

4-{3-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-4-メチル-2-ペンテン酸 エチルエステル;臭

5 化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.182 (3H, 7.2Hz), 1.405 (3H, t, J=7.2Hz), 1.482 (6H, s), 2.817 (3H, d, J=4.8Hz), 4.09
8 (2H, q, J=7.2Hz), 4.274 (2H, q, J=7.2Hz), 4.868 (2H, s), 5.529 (2H, s), 5.821 (1H, d, J
=15.6Hz), 7.026 (1H, d, J=15.6Hz), 7.539 (1H, s), 7.592 (1H, t, J=7.6Hz), 7.713 (1H, d
10 , J=8.0Hz), 7.900 (1H, s), 7.931 (1H, d, J=8.0Hz), 8.206 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s)

実施例 563

4-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール

15 -2-イル)-アセチル]-フェニル}-4-メチル-2-ペンテン酸 エチルエステル;臭化水

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.184 (3H, t, J=7.2Hz), 1.285 (3H, t, J=6.8Hz), 1.390 (3H, t, J=6.8Hz), 1.482 (6H, s),
4.06-4.14 (4H, m), 4.208 (2H, q, J=7.2Hz), 4.817 (2H, s), 5.511 (2H, s), 5.821 (1H, d, J
=15.6Hz), 7.028 (1H, d, J=15.6Hz), 7.335 (1H, s), 7.56-7.61 (1H, m), 7.705 (1H, d, J=8
20 .0Hz), 7.87-7.91 (2H, m).

実施例 564

2-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール

-2-イル)-アセチル]-フェニル}-2-メチル-プロパン酸 メチルエステル;臭化水素

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.284 (3H, t, J=7.2Hz), 1.390 (3H, t, J=6.8Hz), 1.548 (6H, s), 3.590 (3H, s), 4.110 (2H

, q, J=6.8Hz), 4.208 (2H, t, J=7.2Hz), 4.820 (2H, s), 5.517 (2H, s), 7.341 (1H, s), 7.55-7.70 (2H, m), 7.85-7.94 (2H, m).

実施例 565

- 5 2-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-2-メチル-プロパン酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.282 (3H, t, J=6.8Hz), 1.387 (3H, t, J=6.8Hz), 1.514 (6H, s), 4.106 (2H, q, J=6.8Hz), 4.205 (2H, q, J=6.8Hz), 4.818 (2H, s), 5.521 (2H, s), 7.23-7.42 (2H, m), 7.579 (1H, t, J=8.0Hz), 7.705 (1H, d, J=8.0Hz), 7.86-7.93 (2H, m).

- 10 実施例 566

8-第 3 ブチル-6-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イルメチレン-シアナミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.37 (9H, s), 2.70 (3H, s), 4.05 (2H, t, J=5Hz), 4.39 (2H, t, J=5Hz), 5.04 (2H, s), 6.33 (2H, s), 7.49 (1H, d, J=8Hz), 7.86 (1H, d, J=8Hz), 7.87 (1H, d, J=8Hz), 8.43 (1H, d, J=8Hz), 9.70 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 431.0 (MH⁺)

実施例 567

- 20 2-[2-(8-第 3 ブチル-4-シアノイミノメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.36 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7Hz), 2.83 (3H, d, J=5Hz), 4.00 (2H, t, J=5Hz), 4.28 (2H, q, J=7Hz), 4.44 (2H, t, J=5Hz), 4.82 (2H, s), 5.40 (2Hs), 7.51 (1H, s), 7.70 (1H, d, J=2Hz), 8.19 (1H, d, J=2Hz), 8.20 (1H, s), 8.52 (1H, s), 9.44 (

1H, s).

MS:m/e (ESI) 517.0 (MH⁺)

実施例 568

5 8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イルメ
チレン-シアナミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7Hz), 1.36 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7Hz), 4.00 (2H, t, J=5Hz), 4.12 (2H, q, J=7Hz), 4.21 (2H, q, J=7Hz), 4.43 (2H, t, J=5Hz), 4.80 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.32 (1H, s),
10), 7.70 (1H, d, J=2Hz), 8.17 (1H, d, J=2Hz), 9.43 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 522.0 (MH⁺)

実施例 569

4-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインド
ール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-4-メチル-2-ペンテン酸;塩酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.401 (3H, t, J=6.8Hz), 1.472 (6H, s), 2.814 (3H, d, J=4.8Hz), 4.268 (2H, q, J=6.8Hz),
4.862 (2H, s), 5.565 (2H, s), 5.745 (1H, d, J=16.0Hz), 6.969 (1H, d, J=16.0Hz), 7.528 (1H, s), 7.586 (1H, t, J=8.0Hz), 7.69-7.73 (1H, m), 7.89-7.92 (1H, m), 8.209 (1H, q, J=4.8Hz), 8.559 (1H, s), 9.388 (1H, s).

20 実施例 570

4-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール
-2-イル)-アセチル]-フェニル}-4-メチル-2-ペンテン酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.284 (3H, t, J=6.8Hz), 1.389 (3H, t, J=6.8Hz), 1.472 (6H, s), 4.109 (2H, q, J=6.8Hz),
25 4.207 (2H, q, J=6.8Hz), 4.817 (2H, s), 5.545 (2H, s), 5.745 (1h, d, J=16.0Hz), 6.970 (1h, d, J=16.0Hz), 7.332 (1H, s), 7.582 (1H, t, J=8.0Hz), 7.69-7.73 (1H, m), 7.8707.92 (

2H, m), 9.081 (1H, s), 9.466 (1H, s).

実施例 571

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メチルアミノメチルフェニル)-2-オキシ-
エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;塩酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37-1.42 (12H, m), 2.578 (3H, d, J=2.8Hz), 2.806 (3H, d, J=4.4Hz), 4.258 (2H, q, J=6.8Hz), 4.277 (2H, s), 4.843 (2H, s), 5.567 (2H, s), 7.513 (1H, s), 7.861 (1H, d, J=2.4Hz), 8.154 (1H, s), 8.207 (1H, q, J=4.4Hz), 8.559 (1H, s), 9.248 (1H, s), 9.559 (1H, s), 10.001 (1H, s), 10.227 (1H, s).

10

実施例 572

1-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メチルアミノメチルフェニル)-2-(5,6-ジエ
トキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;
塩酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.298 (3H, t, J=6.8Hz), 1.385 (3H, t, J=6.8Hz), 1.396 (9H, s), 2.575 (3H, s), 4.101 (2H, q, J=6.8Hz), 4.201 (2H, q, J=6.8Hz), 4.269 (2H, s), 4.798 (2H, s), 5.519 (2H, s), 7.321 (1H, s), 7.852 (1H, d, J=1.6Hz), 8.092 (1H, s), 9.080 (1H, s), 9.494 (1H, s), 10.179 (1H, s).

20

実施例 573

N-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-コハク酸 エチルエステル;臭
化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25

1.16 (3H, t, J=6.8Hz), 1.33 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 2.56 (2H, d, J=5.6Hz), 2.58 (3H, d, J=5.6Hz), 2.80 (3H, d, J=6.4Hz), 4.04 (2H, q, J=6.8Hz), 4.25 (2H, q, J=6.8Hz),

4. 85 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 29 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 84 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 98 (1H, s), 8. 19 (1H, q, J=5. 2Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 44 (1H, s), 9. 98 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 551. 4 (MH⁺)

実施例 574

- 5 N-(2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル)-N-メチル-コハク酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

- 10 1. 13 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 35 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 13-2. 22 (4H, m), 2. 81 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 08 (3H, s), 3. 98 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 26 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 13 (2H, s), 5. 49 (3H, s), 7. 23 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 51 (1H, s), 7. 94 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 17-8. 21 (2H, m), 8. 52 (1H, brs).

実施例 575

- 15 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メトキシ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

1. 40 (3H, t, J=8. 0Hz), 1. 41 (18H, s), 4. 03 (3H, s), 4. 18 (2H, q, J=8. 0Hz), 4. 73 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 73 (2H, s).

実施例 576

- 20 1-(3-第3ブチル-4-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

- 25 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 38 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (9H, s), 1. 88-1. 95 (4H, m), 2. 90-2. 98 (4H, m), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 20 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 65 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 88 (dd, J=8. 4, 2. 0Hz), 7. 92 (1H, d, J=2. 0Hz).

実施例 577

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸 第3ブチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 28 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 39 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 40 (18H, s), 4. 05 (2H, d, J=6.0Hz), 4. 11 (2H, q, J=7.2Hz) 4. 20 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 75 (2H, s), 5. 36 (2H, s), 5. 87 (1H, t, J=6.0Hz), 6. 53 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 30 (1H, s), 7. 71 (1H, dd, J=8.4, 2.0Hz), 7. 77 (1H, d, J=2.0Hz).

実施例 578

- 10 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 28 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 40 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 40 (9H, s), 4. 09 (2H, brs), 4. 11 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 20 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 38 (2H, s), 6. 57 (1H, d, J=8.8Hz), 7. 32 (1H, brs) 7. 72 (1H, dd, J=8.8, 2.0Hz), 8. 48-9. 03 (1H, m), 9. 30-9. 35 (1H, m).

実施例 579

1-(8-第3ブチル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 92 (3H, s), 3. 89 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 36 (2H, t, J=4.4Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 28 (1H, s), 7. 35 (1H, s), 9. 08 (1H, s), 9. 26 (1H, s).

実施例 580

- 25 2-[2-(8-第3ブチル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-7-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソ

インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 5 1. 34 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 84 (3H, d, J=4.8Hz), 2. 93 (3H, s), 4. 32 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 36 (2H, t, 4.4Hz), 5. 01 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 19 (1H, d, J=2.0Hz), 7. 29 (1H, d, J=2.0Hz), 8. 30 (1H, s), 8. 41 (1H, q, J=4.8Hz), 9. 47 (1H, s), 10. 02 (1H, s).

実施例 581

2-[2-(3-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

- 10 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 43 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 84 (3H, d, J=4.4Hz), 3. 10 (6H, s), 4. 29 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 25 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 93 (1H, m), 8. 23 (2H, m), 8. 58 (1H, s), 9. 46 (1H, s), 9. 95 (1H, s).

実施例 582

- 15 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5-イソプロポキシ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 20 1. 34 (6H, d, J=6.0Hz), 1. 40 (18H, s), 3. 85 (3H, s), 4. 74-4. 85 (3H, m), 5. 47 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 75 (2H, s).

実施例 583

{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5-イソプロポキシ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 25 1. 34 (6H, d, J=6.0Hz), 1. 39 (9H, s), 3. 84 (3H, s), 4. 72-4. 85 (3H, m), 4. 88 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 07 (1H, d, J=7.9Hz), 7. 82-7. 92 (2H, m).

MS:m/e (ESI) 487.2 (MH⁺)

実施例 584

{8-第3ブチル-6-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.34 (9H, s), 1.38 (3H, t, J=7.0Hz), 3.48 (2H, brs), 3.86 (3H, s), 4.14 (2H, s), 4.20 (2H, q, J=7.0Hz), 4.28 (2H, brs), 4.76 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.03 (1H, s), 7.23 (1H, s), 7.32 (1H, s), 9.03 (1H, brs).

10 実施例 585

{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-5-プロボキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 0.98 (3H, t, J=7.6Hz), 1.34 (9H, s), 1.74-1.85 (2H, m), 3.48 (2H, brt, J=4.3Hz), 3.86 (3H, s), 4.08-4.18 (4H, m), 4.28 (2H, brt, J=4.3Hz), 4.77 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.04 (1H, s), 7.23 (1H, s), 7.32 (1H, s), 9.03 (1H, brs).

実施例 586

20 1-(8-第3ブチル-4-エチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.09 (3H, t, J=7.0Hz), 1.30 (3H, t, J=7.6Hz), 1.34 (9H, s), 2.94 (2H, q, J=7.6Hz), 3.35 (2H, t, J=4.4Hz), 3.40 (2H, q, J=7.0Hz), 4.27 (2H, t, J=4.4Hz), 4.84 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.19 (1H, s), 7.21 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=8.0Hz), 8.17 (1H, d, J=8.0Hz).

MS:m/e (ESI) 421.2 (MH⁺)

実施例 587

1-(8-第3ブチル-4-プロピル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

0.90 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$) 1.30 (3H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 1.34 (9H, s), 1.52-1.62 (2H, m), 2.94 (2H, q, $J=7.6\text{Hz}$) 3.27 (2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 3.38 (2H, t, $J=4.4\text{Hz}$), 4.25 (2H, t, $J=4.4\text{Hz}$), 4.84 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.15 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.21 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.72 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8.17 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$).

10 MS: m/e (ESI) 435.2 (MH $^+$)

実施例 588

1-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-ピペリジン-2-オン;臭化水素酸塩

15 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1.26 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.34 (9H, s), 1.68 (4H, br), 2.32 (2H, br), 2.86 (2H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 3.25-3.40 (2H, mr), 4.40 (2H, s), 4.53 (2H, s), 5.12 (2H, s), 7.48 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.77 (1H, br), 7.82 (1H, br), 7.96 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$).

MS: m/e (ESI) 463.2 (MH $^+$)

20 実施例 589

N-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-N-メチル-アセトアミド;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1.30 (3H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 1.37 (9H, s), 2.11 (3H, s), 2.94 (2H, q, $J=7.6\text{Hz}$), 3.10 (3H, s), 4.48 (2H, s), 4.86 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.73 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7.81 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.

90 (1H, d, J=2.0Hz), 8.17 (1H, d, J=8.2Hz), 9.52 (1H, s), 9.85 (1H, s), 11.28 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 437.2 (MH⁺)

実施例 590

5 {2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第 3 ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミ
ノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢
酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.31 (3H, t, J=7.6Hz), 1.40, 1.41 (9H, each s), 2.02, 2.10 (3H, each
s), 2.80, 2.94 (3H, each s), 2.92-2.97 (2H, m), 4.49, 4.52 (2H, each
10 s), 4.62, 4.70 (2H, each s), 4.86, 5.55 (2H, each s), 7.49, 7.53 (1H, each
s), 7.74 (1H, d, J=8.0Hz), 7.84, 7.89 (1H, each
s), 8.18 (1H, d, J=8.0Hz), 9.52 (1H, brs), 9.89 (1H, brs).

実施例 591

15 {2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イ
ミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-
フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.40 (9H, s), 2.01, 2.09 (3H, each s), 2.31 (3H, s), 2.58,
2.79 (3H, each s), 2.93, 3.14 (3H, each s), 3.98 (2H, q, J=7.2Hz), 4.48,
20 4.52 (2H, each s), 4.61, 4.69 (2H, each s), 4.82 (2H, s), 5.52, 5.54 (2H, each s),
7.47, 7.51 (1H, each d, J=2.0Hz), 7.83, 7.88 (1H, each d, J=2.0Hz), 9.43 (1H, s),
9.88 (1H, s).

実施例 592

25 {8-第 3 ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢
酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 00-1. 19 (4H, m), 1. 35 (9H, s), 2. 23-2. 36 (1H, m), 4. 14 (2H, s), 4. 20-4. 37 (2H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 04 (1H, s), 7. 25 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 07 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 52 (1H, brs), 9. 58-9. 63 (1H, m).

5 MS:m/e (ESI) 463. 2 (MH⁺)

実施例 593

6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキシ-2-(1,2,3,3-テトラメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-イル)-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 02 (3H, s), 1. 15 (3H, d, J=6. 4Hz), 1. 27 (3H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 80 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 19 (1H, q, J=3. 4Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 35 (2H, s), 6. 60 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 52 (1H, s), 7. 60 (1H, s), 7. 77 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 20 (1H, d, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 449. 2 (MH⁺)²

実施例 594

2-[2-(5-第 3 ブチル-フラン-3-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 28 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 29 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 24 (2H, s), 6. 48 (1H, d, J=0. 8Hz), 7. 54 (1H, s), 8. 22 (1H, m), 8. 58 (1H, s), 8. 63 (1H, d, J=0. 8Hz).

実施例 595

{2,6-ジ第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-インドル-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39-1. 42 (3H, m), 1. 404 (18H, s), 2. 818 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 266 (2H, s), 4. 272 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 847 (2H, s), 5. 572 (2H, s), 7. 534 (1H, s), 7. 891 (2H, s), 8. 214 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 554 (1H, s), 9. 309 (1H, s), 9. 309 (1H, s), 9. 913 (1H, s).

実施例 596

- 5 1,2,6-ジ第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 285 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 34-1. 45 (21H, s), 4. 110 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 209 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 262 (2H, s), 4. 796 (2H, s), 5. 555 (2H, s), 7. 333 (1H, s), 7. 878 (2H, s), 9. 085 (1H, s), 9. 412 (1H, s).

実施例 597

- 15 1-{3-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-シクロペンタンカルボン酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 386 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 50-1. 77 (6H, m), 2. 37-2. 50 (2H, m), 2. 806 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 256 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 919 (2H, s), 4. 97-5. 04 (1H, m), 7. 15-7. 42 (4H, m), 7. 478 (1H, s), 8. 14-8. 21 (1H, m), 8. 534 (1H, s).

実施例 598

- 20 1-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-シクロペンタンカルボン酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 264 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 379 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 55-1. 77 (6H, m), 2. 43-2. 50 (2H, m), 4. 075 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 188 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 879 (2H, s), 4. 95-5. 02 (1H, m), 7. 23-7. 40 (5H, m).

25 実施例 599

- 1-{3-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-シクロペンタンカルボン酸;塩酸塩

ール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-シクロペンタンカルボン酸 エチルエステ
ル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 079 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 408 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 60-1. 74 (4H, m), 1. 83-1. 94 (2H, m),
2. 52-2. 60 (2H, m), 2. 821 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 016 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 276 (2H, q, J=6. 8
Hz), 4. 871 (2H, s), 5. 520 (2H, s), 7. 52-7. 72 (2H, m), 7. 884 (1H, s), 7. 924 (1H, d, J=7. 6
Hz), 8. 215 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 554 (1H, s).

実施例 600

- 10 1-{3-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール
-2-イル)-アセチル]-フェニル}-シクロペンタンカルボン酸 エチルエステル;臭
化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 079 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 287 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 393 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 60-1. 74 (4H
, m), 1. 84-1. 94 (2H, m), 2. 52-2. 60 (2H, m), 4. 016 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 113 (2H, q, J=7. 2
Hz), 4. 211 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 822 (2H, s), 5. 504 (2H, s), 7. 339 (1H, s), 7. 582 (1H, t, J
=8. 0Hz), 7. 691 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 877 (1H, s), 7. 911 (1H, d, J=7. 6Hz).

実施例 601

- 20 6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキシ-2-(1, 3, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-イン
ドール-5-イル)-エチル]-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチ
ルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 27 (6H, s) 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 86 (3H, s), 3. 28 (2H, s), 4.
28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 32 (2H, s), 6. 57 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 51 (1H, s), 7. 5
9 (1H, s), 7. 76 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 17-8. 23 (1H, m), 8. 54 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 72 (1H, brs).

実施例 602

1-[3-第3ブチル-4-(2H-テトラゾール-5-イルメトキシ)-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;

塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.26-1.43 (15H, m), 4.11 (2H, q, J=7.2Hz), 4.21 (2H, q, J=7.2Hz), 4.80 (2H, s), 5.46 (2H, s), 5.63 (2H, s), 6.94-7.06 (1H, m), 7.31-7.45 (3H, m), 9.04 (1H, brs), 9.33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 511.2 (MH⁺)

実施例 603

- 10 2-[2-(8-第3ブチル-4-カルバモイルメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-7-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.34 (3H, t, J=7.2Hz), 1.38 (9H, s), 2.84 (3H, d, J=4.4Hz), 3.51 (2H, t, J=4.4Hz), 3.90 (2H, s), 4.31 (2H, q, J=7.2Hz), 4.34 (2H, t, J=4.4Hz), 5.00 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.01 (1H, s), 7.13 (1H, s), 7.27 (1H, s), 7.52 (1H, s), 8.30 (1H, s), 8.41 (1H, q, J=4.4Hz), 9.47 (1H, s), 10.02 (1H, s).

実施例 604

- 20 2-{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.31 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 3.51 (2H, t, J=4.4Hz), 3.90 (2H, s), 4.13 (2H, q, J=6.8Hz), 4.22 (2H, q, J=6.8Hz), 4.34 (2H, J=4.4Hz), 4.79 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.00 (1H, d, J=2.0Hz), 7.13 (1H, s), 7.26 (1H, d, J=2.0Hz), 7.34 (1H, s), 7.51 (1H, s), 9.02 (1H, s), 9.35 (1H, s).

実施例 605

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-6-エトキシ-3-イミ
ノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 5 1.29(18H, s), 1.41(3H, t, J=7.2Hz), 2.83(3H, d, J=4.4Hz), 2.90(2H, t, J=7.2Hz), 3.9
3(2H, t, J=7.2Hz), 4.27(2H, q, J=7.2Hz), 4.75(2H, s), 6.81(1H, s), 6.92(2H, s), 7.47
(1H, s), 8.18(1H, q, J=4.4Hz), 8.56(1H, s), 9.17(1H, s), 9.71(1H, s).

実施例 606

- 10 1-[8-第3ブチル-4-(3-ヒドロキシ-プロピル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オ
キサジン-6-イル]-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン
-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 15 1.31(3H, t, J=7.4Hz), 1.34(9H, s), 1.71(2H, m), 2.94(2H, q, J=7.4Hz), 3.26-3.72(6H
, m), 4.26(2H, t, J=4.8Hz), 4.85(2H, s), 5.53(2H, s), 7.21(2H, s), 7.73(1H, d, J=8.0H
z), 8.17(1H, d, J=8.0Hz), 9.55(1H, s), 9.85(1H, s).

MS:m/e(ESI) 451

実施例 607

- 20 2-{2-[8-第3ブチル-4-(3-ヒドロキシ-プロピル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]
オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-
イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 25 0.90(3H, t, J=7.2Hz) 1.30(3H, t, J=7.6Hz), 1.34(9H, s), 1.52-1.62(2H, m), 2.94(2H,
q, J=7.6Hz) 3.27(2H, t, J=7.4Hz), 3.38(2H, t, J=4.4Hz), 4.25(2H, t, J=4.4Hz), 4.84(
2H, s), 5.54(2H, s), 7.15(1H, d, J=2.0Hz), 7.21(1H, d, J=2.0Hz), 7.72(1H, d, J=8.0Hz
) , 8.17(1H, d, J=8.0Hz).

実施例 608

6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキシ-2-(1,4,4-トリメチル-2-オキシ-1,2,3,4-テ
トラヒドロキノリン-6-イル)-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カ
ルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 27 (6H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 54 (2H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 29 (2H, s), 4
. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 32 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 54 (1H, s), 7.
89 (1H, s), 7. 95 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 18-8. 24 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 24 (1H, brs), 9. 86
(1H, brs).

実施例 609

- 10 {2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ
-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェ
ノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39 (12H, s), 2. 01, 2. 10 (3H, each s), 2. 80, 2. 94 (3H, each
s), 4. 11, 4. 22 (2H, each brd, J=6. 8Hz), 4. 48, 4. 52 (2H, each s), 4. 61, 4. 69 (2H, each
s), 4. 80 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 48, 7. 51 (1H, each
s), 7. 83, 7. 87 (1H, each s), 9. 06 (1H, s), 9. 32 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 572. 3 (MH⁺)

実施例 610

- 20 {2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ
-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェ
ノキシ}-酢酸 メチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39 (12H, s), 2. 01, 2. 09 (3H, each s), 2. 80, 2. 94 (3H, each
s), 3. 75, 3. 77 (3H, each
s), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 06 (2H, s), 4. 64, 4. 68 (2H, each

s), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 47, 7. 52 (1H, each s), 7. 83, 7. 87 (1H, each d, J=2. 0Hz), 9. 06 (1H, each s).

MS:m/e (ESI) 586. 4 (MH⁺)

実施例 611

- 5 2-[2-(7-第 3 ブチル-2-シアノアミノ-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 , 1. 08 (3H, t, J=7Hz), 1. 44 (9H, s), 2. 84 (3H, d, J=5Hz), 4. 28 (2H, q, J=7Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 5. 55 (1H, q, J=5Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 8. 21 (1H, s), 8. 56 (1H, s)

実施例 612

- 15 {8-第 3 ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 , 1. 28-1. 42 (12H, m), 2. 78 (3H, d, J=4. 5Hz), 3. 48 (2H, brt, J=4. 5Hz), 4. 15 (2H, s), 4. 24 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 30 (2H, brt, J=4. 5Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 03 (1H, s), 7. 25 (1H, s), 7. 98 (1H, s), 8. 54 (qH, brq, J=4. 5Hz), 9. 48 (1H, brd, J=7. 0Hz), 9. 93 (1H, brd, J=7. 0Hz).

実施例 613

- 25 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(6-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 41 (18H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 10 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s),

5. 48 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 07 (1H, brs), 9. 06 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

実施例 614

{8-第3 ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-

5 酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (9H, s), 3. 49 (2H, brs), 3. 64 (3H, s), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 25-4. 34 (3H, m),
4. 78 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 03 (1H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 35 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 514. 3 (MH⁺)

10 実施例 615

2-{8-第3 ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロ
ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン
-4-イル}-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 4Hz), 2. 33 (3H, s), 2. 60 (3H, s), 3. 51 (2H, s), 3. 90 (2H, s),
4. 00 (2H, q, J=6. 4Hz), 4. 35 (2H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 01 (1H, s), 7. 13 (1H,
s), 7. 27 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 9. 40 (1H, s), 9. 81 (1H, s).

実施例 616

{3-第3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-酢酸; 2 トリフ
ルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 38 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 41 (9H, s), 3. 79 (2H, brs), 4. 12 (2H, q,
J=7. 2Hz), 4. 23 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 25 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 33 (1H, s),
25 7. 84 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 9. 07 (1H, s), 9. 37 (1H, s).

実施例 617

{6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 32 (6H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 57 (2H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 77 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 25 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 87-7. 94 (2H, m), 8. 17-8. 25 (1H, m), 8. 57 (1H, s), 9. 26 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 507. 3 (MH⁺)

実施例 618

- 10 1-(5-第 3 ブチル-フラン-3-イル)-2-(4-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (9H, s), 1. 35 (3H, t, J=7. 2Hz), 4. 20 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 22 (2H, s), 6. 48 (1H, d, J=0. 4Hz), 7. 41-7. 54 (2H, m) 8. 61 (1H, d, J=0. 4Hz).

- 15 実施例 619

1-(5-第 3 ブチル-フラン-3-イル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 29 (9H, s), 1. 31 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 4. 13 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 23 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 22 (2H, s), 6. 48 (1H, d, J=0. 8Hz), 7. 34 (1H, s), 8. 60 (1H, d, J=0. 8Hz), 9. 10 (1H, s), 9. 41 (1H, s).

実施例 620

- 25 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-イソプロポキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (6H, d, J=6.0Hz), 1. 41 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 67 (1H, m), 4. 86 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, m), 8. 59 (1H, s), 9. 24 (1H, s), 9. 87 (1H, s).

実施例 621

5 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-シクロペンチルオキシ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 41 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 58 (2H, m), 1. 73-2. 00 (6H, m), 2. 85 (3H, d, J=4. 4 Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 4. 87 (1H, m), 5. 49 (2H, s), 7. 40 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, m), 8. 60 (1H, s), 9. 22 (1H, s), 9. 86 (1H, s).

実施例 622

15 {3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 167 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 373 (9H, s), 1. 409 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 822 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 757 (3H, s), 3. 819 (2H, s), 4. 102 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 277 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 856 (2H, s), 5. 494 (2H, s), 7. 536 (1H, s), 7. 846 (1H, s), 8. 215 (1H, s), 8. 204 (1H, s), 8. 551 (1H, s).

実施例 623

25 {3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 164 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 285 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 370 (9H, s), 1. 391 (3H, t, J=7. 2Hz),

3. 753 (3H, s), 3. 817 (2H, s), 4. 06-4. 14 (4H, m), 4. 207 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 803 (2H, s),
5. 469 (2H, s), 7. 344 (1H, s), 7. 832 (2H, s).

実施例 624

5 6-[2-(8-第 3 ブチル-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イ
ル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 38 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 79 (3H, d, J=4. 0Hz), 2. 93 (3H, s), 3. 33 (2H, s), 4
10 . 26 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 36 (2H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 29 (1H, s)
, 8. 01 (1H, s), 8. 59 (1H, q, J=4. 0Hz), 9. 55 (1H, s), 9. 97 (1H, s).

実施例 625

15 6-[2-(8-第 3 ブチル-4-カルバモイルメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキ
サジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロ
ロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (12H, s), 2. 79 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 91 (2H, s), 4. 25 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 34 (2H, t, J
=4. 4Hz), 4. 89 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 02 (1H, s), 7. 14 (1H, s), 7. 27 (1H, s), 7. 55 (1H, s
) , 8. 00 (1H, s), 8. 57 (1H, q, J=4. 8Hz), 9. 52 (1H, s), 9. 94 (1H, s).

実施例 626

20 {2-第 3 ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸;トリ
フルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 83-1. 93 (4H, m), 3. 06-3. 16 (4H, m), 4. 27 (2H, q,
25 J=6. 8Hz), 4. 40 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 41 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 7. 54 (1H,
s), 7. 70 (1H, brs), 7. 79 (1H, brs), 8. 62 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 537.3 (MH⁺)

実施例 627

{2-第 3 ブチル-4-[2-(6-ジメチルカルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-

5 酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.34 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.84-1.93 (4H, m), 2.78 (3H, s), 3.00 (3H, s), 3.08-3.15 (4H, m), 4.22 (2H, q, J=6.8Hz), 4.40 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.42 (1H, s), 7.48 (1H, s), 7.50 (1H, s), 8.03 (1H, s), 9.13 (1H, brs), 9.69 (1H, brs).

10 MS:m/e (ESI) 565.4 (MH⁺)

実施例 628

{2-第 3 ブチル-4-[2-(6-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.28 (3H, t, J=6.7Hz), 1.40 (9H, s), 3.93 (3H, s), 4.10 (2H, q, J=6.7Hz), 4.80 (2H, s), 4.88 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.06 (1H, d, J=8.0Hz), 7.34 (1H, s), 7.80-7.92 (2H, m), 9.06 (1H, brs), 9.37 (1H, brs).

実施例 629

{8-第 3 ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ [1,4] オキサジン-4-イル}-酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.30-1.41 (12H, m), 2.77 (3H, d, J=4.8Hz), 3.48 (2H, brs), 3.64 (3H, s), 4.20-4.33 (6H, m), 4.86 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.04 (1H, s), 7.26 (1H, s), 7.98 (1H, s), 8.52 (1H, q, J=4.8Hz).

25

実施例 630

8-第 3 ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ
ジン-2-カルボン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 38 (9H, s), 2. 88 (3H, s), 3. 23-3. 42 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 15 (1H, t, J=3. 9Hz), 5. 45 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 35 (1H, s).

実施例 631

(アセチル-{2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸 第
3 ブチル エステル;臭化水素酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 32 (9H, s), 1. 42 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 74 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz) 3. 68 (1H, d, J=16. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 49 (1H, d, J=16. 8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 73 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 98 (1H, dd, J=8. 0, 2. 0Hz), 8. 15 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s).

実施例 632

(アセチル-{2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸;塩
酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 73 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 67 (1H, d, J=16. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 56 (1H, d, J=16. 8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 58 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 75 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 97 (1H, dd, J=8. 0, 2. 0Hz), 8. 17 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 34-9. 40 (1H, m), 9. 90-9. 98 (1H, m).

25 実施例 633

({2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド

ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸 第3ブ
チル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=5. 2Hz), 1. 44 (18H, s), 2. 59 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 49 (1H, brs
5), 4. 27 (2H, q, J=5. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 64 (1H, d, J=8. 4Hz)
, 7. 90 (1H, dd, J=8. 4, 2. 4Hz), 7. 94 (1H, d, J=2. 4Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s
).

実施例 634

{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモ
10 イル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリ
フルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 95 (6H, t, J=7. 2Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 0Hz), 3. 11
(4H, q, J=7. 2Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 73 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 54 (
15 2H, s), 7. 59 (1H, s), 8. 20 (1H, brs), 8. 55 (1H, s), 9. 17 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 553. 3 (MH⁺)

実施例 635

({2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
20 ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 44 (9H, s), 2. 62 (3H, s), 2. 82 (3H, s), 3. 83 (1H, d, J=8. 8Hz), 4
. 17 (1H, d, J=8. 8Hz), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 54 (2H, s) 6. 34 (1H, s), 7. 6
6 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 91 (1H, dd, J=8. 0, 1. 6Hz), 7. 94 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 56 (1H, s), 9.
29-9. 33 (1H, m), 9. 48-9. 92 (1H, m).

25 実施例 636

{2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-

ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 85-1. 90 (4H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 07-3. 15 (4H, m),
5 , 4. 39 (2H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 40 (1H, s), 7. 47 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 36 (1H, brs), 8. 90 (1H, brs), 9. 53 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 550. 4 (MH⁺)

実施例 637

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-イソプロポキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 41 (9H, s), 2. 80 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 94 (6H, s), 4. 68 (1H, m), 4
15 , 76 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 10 (1H, s), 8. 39 (1H, m).

実施例 638

2-[2-(4-アセチル-8-第3ブチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 30 (3H, s), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 91 (2H, t, J=4. 8Hz), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 48 (2H, t, J=4. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 67 (1H, s), 8. 00 (1H, brs), 8. 22 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 22 (1H, s), 9
20 . 84 (1H, s).

25 実施例 639

{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモ

イル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.94 (6H, t, J=6.8Hz), 1.23 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.83
5 (3H, d, J=4.8Hz), 3.05-3.10 (4H, m), 4.17 (2H, q, J=6.8Hz), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.8
0 (2H, s), 4.84 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.61 (1H, s), 8.21 (1H, d
, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.29 (1H, brs), 9.90 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 581.4 (MH⁺)

実施例 640

10 {3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-酢酸;臭化水素
酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.38 (3H, t, J=7.2Hz), 1.41 (9H, s), 3.79 (2H, brs), 4.12 (2H, q,
15 J=7.2Hz), 4.23 (2H, q, J=7.2Hz), 4.25 (2H, s), 4.80 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.33 (1H, s),
7.84 (1H, s), 7.91 (1H, s), 9.07 (1H, s), 9.37 (1H, s).

実施例 641

20 [2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル]-アセチル]-6-(エチル-メタンスルフォニル-アミノ)-
フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.05 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.27
(3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.69-4.93 (6H, m), 5.52 (2H, s), 7.55 (1H, s), 7.86 (1H,
s), 7.89 (1H, s), 8.21 (1H, d, J=4.4Hz), 8.56 (1H, s), 9.24 (1H, brs), 9.88 (1H, brs).

25 MS:m/e (ESI) 603.3 (MH⁺)

実施例 642

{2-(アセチル-エチル-アミノ)-6-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.05 (3H, t, J=6.8Hz), 1.33-1.43 (12H, m), 1.89 (3H, s), 2.82 (3H, d, J=4.8), 2.96-3.12 (1H, m), 4.08-4.19 (1H, m), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.48 (2H, dd, J=15.2Hz, 15.6Hz), 4.86 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.81 (1H, s), 7.89 (1H, s), 8.21 (1H, d, J=4.4Hz), 8.56 (1H, s), 9.26 (1H, brs), 9.88 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 567.3 (MH⁺)

10 実施例 643

{2-(アセチル-メチル-アミノ)-6-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.36-1.43 (12H, m), 1.83 (3H, s), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 3.15 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.44 (2H, dd, J=15.6Hz, 15.6Hz), 4.85 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.87 (1H, s), 7.95 (1H, s), 8.21 (1H, d, J=4.4Hz), 8.55 (1H, s), 9.23 (1H, brs), 9.88 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 553.3 (MH⁺)

実施例 644

- 20 {2-第3ブチル-4-[2-(1-イミノ-6-メチルカルバモイル-5-プロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 0.98 (3H, t, J=7.6Hz), 1.23 (3H, t, J=7.2Hz), 1.38 (9H, s), 1.85-1.90 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.06-3.12 (4H, m), 4.17 (2H, q, J=6.4Hz), 4.20 (2H, q, J=7.2), 4.49 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.42 (1H, br), 7.49 (1H, br), 7.54 (1H, s), 8.52 (1H, s), 9

. 15 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

実施例 645

{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-イソプロポキシ-フェノキシ}-酢酸;臭化

5 水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 39 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 64 (2H, s), 4. 75 (1H, m), 4. 87 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 22 (1H, m), 8. 59 (1H, s), 9. 28 (1H, m), 9. 89 (1H, s).

10 実施例 646

{2-第3ブチル-6-シクロペンチルオキシ-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカ
ルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢
酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 38 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 63 (2H, m), 1. 69-1. 83 (4H, m), 1. 95 (2H, m), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 59 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 4. 93 (1H, m), 5. 55 (2H, s), 7. 48 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 22 (1H, m), 8. 59 (1H, s), 9. 88 (1H, s).

実施例 647

20 7-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾオキサゾール-2-イル-シアナミド;臭化水
素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 39 (3H, t, J=7Hz), 1. 48 (3H, t, J=7Hz), 1. 51 (9H, s), 4. 20 (2H, q, J=7Hz), 4. 25 (2H, J=7Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 22 (1H, s), 7. 91 (2H, d, J=2Hz), 8. 11 (2H, J=2Hz).

MS:m/e (ESI) 512. 0 (MH⁺)

実施例 648

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 23 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 37 (9H, s), 1. 82-1. 91 (4H, m), 2. 77 (3H, d, $J=4.4\text{Hz}$), 2. 91 (6H, s), 3. 04-3. 14 (4H, m), 4. 21 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 49 (2H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 33-8. 41 (1H, m), 8. 93 (1H, brs), 9. 54 (1H, brs).

10 MS:m/e (ESI) 578. 3 (MH $^+$)

実施例 649

(アセチル-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-アミノ)-酢酸 メチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

15 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 06 (3H, s), 3. 67 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 96 (3H, s), 4. 40 (2H, s), 4. 52 (2H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 79 (1H, s), 7. 94 (1H, s), 9. 06 (1H, s), 9. 34 (1H, s), 10. 90 (1H, s).

実施例 650

20 {2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 33 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 1. 38 (9H, s), 2. 80 (3H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 4. 26 (2H, s), 4. 26 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4. 82 (2H, s), 5. 38 (2H, s), 7. 49 (1H, d, $J=6.0\text{Hz}$), 7. 52 (1H, s), 7. 73 (1H, dd, $J=6.0, 2.0\text{Hz}$), 7. 77 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 8. 15-8. 24 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 18-9. 23 (1H, m),

9. 78-9. 82 (1H, m).

実施例 651

{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸 エチルエステル;臭

5 化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 19 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4, 12
 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 18 (2H, d, J=6. 4Hz), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 36 (2H,
 s), 5. 92 (1H, t, J=6. 8Hz), 6. 57 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 51 (1H, s) 7. 72 (1H, dd, J=8. 8, 2. 0H
 z), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 54 (1H, s).

10

実施例 652

2-[2-(8-第3ブチル-3-オキシ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イ
ル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 72
 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 44 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 56 (2H, s), 8. 22 (1H, q, J=4
 . 4Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 20 (1H, s), 9. 86 (1H, s), 10. 95 (1H, s).

実施例 653

20 2-[2-(8-第3ブチル-4-メチル-3-オキシ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジ
ン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 37 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=
 6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 4. 88 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 64 (1H, d, J=1. 6Hz), 7.
 66 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 23 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 24 (1H, s), 9. 88 (1H, s).

25

実施例 654

2-[2-(8-第 3 ブチル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 36 (9H, s), 2. 79 (3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 2. 92 (3H, s), 2. 93 (6H, s), 4. 35 (2H, t, $J=4.4$), 4. 7
5 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 16 (1H, s), 7. 18 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7. 29 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 8. 08
(1H, s), 8. 39 (1H, q, $J=4.8\text{Hz}$), 8. 99 (1H, s), 9. 53 (1H, s).

実施例 655

10 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪
酸;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1. 85-1. 94 (4H, m), 1. 97-2. 06 (2H, m), 2. 36-2. 44 (
2H, m), 2. 82 (3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 3. 07-3. 16 (4H, m), 3. 85 (2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 27 (2H, q, $J=$
7. 2Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 41-5. 50 (2H, m), 7. 36 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 16-
8. 24 (1H, m), 8. 55 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 579. 4 (MH $^+$)

実施例 656

20 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸;ト
リフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1. 29 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 35-1. 42 (12H, m), 1. 82-1. 92 (4H, m), 1. 94-2. 08 (2H, m), 2. 41
(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 3. 06-3. 16 (4H, m), 3. 60-3. 80 (2H, m), 4. 11 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 20 (2
H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 78 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 35 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7. 45 (1H

, d, J=2.4Hz).

MS:m/e (ESI) 584.4 (MH⁺)

実施例 657

5 5-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.60-1.70 (2H, m), 1.75-1.84 (2H, m), 1.86-1.94 (4H, m), 2.29 (2H, t, J=7.2Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.08-3.17 (4H, m), 3.78-3.92 (2H, m), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.83 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.03-8.27 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.15 (1H, brs), 9.84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 593.4 (MH⁺)

実施例 658

15 5-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.28 (3H, t, J=6.8Hz), 1.33-1.46 (12H, m), 1.60-1.71 (2H, m), 1.75-1.84 (2H, m), 1.85-1.96 (4H, m), 2.29 (2H, t, J=7.2Hz), 3.07-3.18 (4H, m), 3.76-3.93 (2H, m), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.78 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.35 (1H, s), 7.45 (1H, s), 9.06 (1H, brs), 9.28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 598.4 (MH⁺)

実施例 659

25 {2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 23 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 26-1. 44 (12H, m), 1. 87 (4H, brs), 2. 77 (3H, s), 3. 11 (4H, brs), 4. 14-4. 30 (4H, m), 4. 49 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 8. 53 (1H, brd), 9. 46 (1H, brs), 9. 97 (1H, brs).

5 実施例 660

[2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 27-1. 46 (12H, m), 2. 02-2. 16 (2H, m), 2. 42 (2H, d, J=8.1Hz), 2. 82 (3H, d, J=4.5Hz), 3. 63 (2H, t, J=7.0Hz), 4. 27 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 45 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 84 (2H, s), 8. 17-8. 23 (1H, m), 8. 55 (1H, s).

実施例 661

15 [2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 26 (3H, t, J=7.1Hz), 1. 33-1. 45 (12H, m), 2. 04-2. 17 (2H, m), 2. 42 (2H, t, J=8.0Hz), 3. 63 (2H, brt, J=6.2Hz), 4. 11 (2H, q, J=7.1Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.1Hz), 4. 43 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 82 (1H, s), 7. 83 (1H, s).

実施例 662

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 27 (18H, s), 1. 33 (3H, t, J=7Hz), 4. 18 (2H, q, J=7Hz), 4. 71 (2H, s), 5. 39 (2H, s), 7. 06 (1H, s), 7. 65 (2H, s), 8. 53 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 448.0 (MH⁺)

実施例 663

7-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル-シアナミド;塩

5 酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (3H, t, J=7Hz), 1.45 (3H, t, J=7Hz), 1.54 (9H, s), 4.18 (2H, q, J=7Hz), 4.26 (2H, q, J=7Hz), 4.92 (2H, s), 5.59 (2H, s), 7.23 (2H, s), 8.06 (1H, s), 8.22 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 511.0 (MH⁺)

10 実施例 664

2-[2-(8-第3ブチル-4-メチル-2-オキシ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.41 (9H, s), 1.44 (3H, t, J=6.8Hz), 2.77 (3H, s), 2.85 (3H, d, J=4.8Hz), 3.61 (2H, s), 4.30 (2H, q, J=6.8Hz), 4.86 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.56 (1H, s), 7.67 (1H, d, J=2.0Hz), 7.86 (1H, d, J=2.0Hz), 8.22 (1H, m), 8.59 (1H, s).

実施例 665

20 3-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイルアミノ}-プロパン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.39 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=6.8Hz), 2.50 (2H, t, J=6.8Hz), 3.42 (2H, t, J=6.8Hz), 4.28 (2H, t, J=6.8Hz), 4.88 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.32 (1H, d, J=8.0Hz), 7.54 (1H, s), 7.85 (1H, t, J=7.6Hz), 8.00 (1H, s), 8.21 (1H, d, J=4.8Hz), 8.52 (1H, t, J=5.2), 8.57 (1H, s), 9.28 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 523. 3 (MH⁺)

実施例 666

2-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイルアミノ}-プロパン酸;トリフ

5 ルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 17-1. 44 (15H, m), 2. 83 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 39-4. 42 (1H, m), 4. 88 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 40 (1H, d, J=7. 6Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 88 (1H, d, J=9. 6Hz), 8. 01 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 8. 81 (1H, d, J=7. 6Hz), 9. 28 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

10

MS:m/e (ESI) 523. 3 (MH⁺)

実施例 667

{2-シクロペンチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸

15 塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 52-1. 69 (4H, m), 1. 70-1. 80 (2H, m), 1. 93-2. 05 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 05 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 83 (1H, s), 7. 85 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4. 0Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

20

MS:m/e (ESI) 494. 4 (MH⁺)

実施例 668

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-酢酸;トリフル

25 オロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 70 (6H, s), 4. 12 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 66 (2H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 30 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 530. 3 (MH⁺)

5 実施例 669

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノ-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 0. 95 (6H, t, J=7. 2Hz) 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 10 (4H, q, J=7. 2Hz), 4. 13 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 72 (2H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 59 (1H, s), 9. 05 (1H, brs), 9. 29 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 558. 4 (MH⁺)

実施例 670

15 2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 39 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 1. 95-2. 03 (2H, m), 2. 25-2. 31 (2H, m), 2. 83 (3H, d, J=5Hz), 4. 03-4. 08 (2H, m), 4. 28 (2H, q, J=7Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 43 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=5Hz), 8. 53 (1H, s), 9. 17 (brs, 1H), 9. 46 (s, 1H).

実施例 671

25 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 23 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37-1. 41 (12H, m), 2. 67 (6H, s), 4. 10 (4H, q, J=6. 8Hz), 4. 20 (4H, q, J=7. 2Hz), 4. 73 (2H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 45 (1H, s), 7. 31 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 39 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 558. 4 (MH⁺)

実施例 672

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノ-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 94 (6H, t, J=7. 2Hz), 1. 23 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (6H, t, J=7. 2Hz), 3. 07 (4H, q, J=7. 2), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 20 (4H, q, J=7. 2Hz), 4. 80 (4H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 60 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 39 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 586. 3 (MH⁺)

実施例 673

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-6-エチルカルバモイル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 13 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 85-1. 93 (4H, m), 3. 06-3. 15 (4H, m), 4. 25 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 40 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 41 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 23 (1H, t, J=4. 8Hz), 8. 51 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

25 MS:m/e (ESI) 565. 4 (MH⁺)

実施例 674

{2-第 3. ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-プロピルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 0.93 (3H, t, J=7.2Hz), 1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.49-1.57 (2H, m), 1.85-1.92 (4H, m), 3.06-3.15 (4H, m), 3.21-3.29 (2H, m), 4.25 (2H, q, J=7.2Hz), 4.40 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.41 (1H, s), 7.48 (1H, s), 7.52 (1H, s), 8.22 (1H, t, J=4.8Hz), 8.50 (1H, s), 9.22 (1H, brs), 9.86 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 579.4 (MH⁺)

10 実施例 675

{2-第 3. ブチル-4-[2-(5-エトキシ-6-エチルカルバモイル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.13 (3H, t, J=7.2Hz), 1.23 (3H, t, J=7.2Hz), 1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.84-1.91 (4H, m), 3.06-3.14 (4H, m), 4.17-4.28 (4H, m), 4.49 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.43 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.52 (1H, s), 8.23 (1H, t, J=4.8Hz), 8.52 (1H, s), 9.24 (1H, brs), 9.86 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 593.4 (MH⁺)

20 実施例 676

{2-第 3. ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-プロピルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 0.92 (3H, t, J=7.2Hz), 1.23 (3H, t, J=7.2Hz), 1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.50-1.58 (2H, m), 1.84-1.92 (4H, m), 3.07-3.14 (4H, m), 3.21-3.28 (2H, m), 4.17-4.28 (4H

, m), 4. 49 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 43 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 22 (1H, t, J=4. 8Hz), 8. 50 (1H, s), 9. 19 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 607. 4 (MH⁺)

実施例 677

- 5 1-(3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-5-オキシ-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 27 (6H, t, J=7Hz), 1. 39 (9H, s), 2. 29-2. 35 (1H, m), 2. 54-2. 75 (2H, m), 2. 95 (1H, dd, J=12, 9Hz), 3. 20 (3H, d, J=5Hz), 4. 15-4. 28 (3H, m), 4. 35 (2H, q, J=7Hz), 4. 54 (1H, d, J=19Hz), 5. 30 (1H, d, J=11Hz), 5. 40 (1H, d, J=19Hz), 5. 33 (1H, d, J=11Hz), 7. 17 (1H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 95 (1H, d, J=2Hz) 8. 17 (1H, q, J=5Hz), 8. 38 (1H, s), 8. 78 (1H, d, J=2Hz), 9. 45 (1H, brs), 10. 02 (1H, br. 2), 10. 08 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 579. 0 (MH⁺)

- 15 実施例 678

1-(3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-5-オキシ-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 28 (3H, t, J=7Hz), 1. 41 (3H, t, J=7Hz), 1. 42 (9H, s), 1. 54 (3H, t, J=7Hz), 2. 24-2. 31 (1H, m), 2. 58 (1H, ddd, J=14, 8, 3Hz), 2. 66 (td, J=14, 5Hz), 2. 93 (1H, ddd, J=14, 11, 8Hz), 4. 16-4. 28 (7H, m), 4. 70 (1H, d, J=19Hz), 5. 05 (1H, d, J=19Hz), 5. 17 (1H, d, J=19Hz), 5. 32 (1H, d, J=19Hz), 6. 88 (1H, s), 7. 93 (1H, d, J=2Hz), 8. 35 (1H, d, J=2Hz), 8. 83 (1H, s).

- 25 MS:m/e (ESI) 584. 0 (MH⁺)

実施例 679

1-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 18 (3H, t, J=7Hz), 1. 42 (9H, s), 1. 60 (3H, t, J=7Hz), 2. 32-2. 36 (1H, m), 2. 54-2. 67 (2H, m), 2. 77-2. 84 (1H, m), 3. 16 (3H, d, J=5Hz), 3. 80 (3H, s), 4. 11-4. 22 (2H, m), 4. 36 (2H, q, J=7Hz), 4. 74 (1H, d, J=19Hz), 4. 75 (1H, m), 4. 93 (1H, d, J=19Hz), 5. 69 (1H, d, J=18Hz), 6. 56 (1H, d, J=18Hz), 7. 21 (1H, s), 7. 25 (1H, s), 8. 05 (1H, d, J=2Hz), 8. 13 (1H, d, J=2Hz), 8. 19 (1H, q, J=5Hz), 9. 48 (1H, s).

- 10 MS:m/e (ESI) 593. 0 (MH⁺)

実施例 680

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

- 15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 18 (3H, t, J=7Hz), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 1. 43 (9H, s), 1. 54 (3H, t, J=7Hz), 2. 31-2. 36 (1H, m), 2. 54-2. 65 (2H, m), 2. 76-2. 84 (1H, m), 3. 81 (3H, s), 4. 15-4. 23 (6H, m), 4. 65 (1H, d, J=18Hz), 4. 74 (1H, dt, J=2, 6Hz), 4. 86 (1H, d, J=18Hz), 5. 61 (1H, d, J=19Hz), 6. 87 (1H, s), 6. 98 (1H, brs), 8. 03 (1H, d, J=2Hz), 8. 11 (1H, d, J=2Hz).

- 20 MS:m/e (ESI) 593. 0 (MH⁺)

実施例 681

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-7-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 44 (18H, s), 2. 86 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 8

3 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 7. 81 (1H, s), 8. 34 (1H, s), 8. 72 (1H, m).

実施例 682

2-[2-(5-第 3 ブチル-2-オキシ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-7-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン

5 酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 43 (12H, m), 2. 45 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 18 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 41 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 56 (1H, s), 7. 61 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 23 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 22 (1H, s), 9. 86 (1H, s), 10. 33 (1H, s).

10

実施例 683

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;トリフルオロ酢酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 93-2. 04 (2H, m), 2. 28 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 05 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 6. 83 (1H, brs), 7. 33 (1H, brs), 7. 44 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 70 (1H, brs), 7. 78 (1H, brs), 8. 63 (1H, s), 9. 18 (1H, brs), 9. 46 (1H, s), 9. 82 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 511. 3 (MH⁺)

実施例 684

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 ジメチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29-1. 46 (12H, m), 1. 93-2. 06 (2H, m), 2. 23-2. 33 (2H, m), 2. 78 (3H, s), 2. 99 (3H, s), 4

. 01-4. 12 (2H, m), 4. 17-4. 28 (2H, m), 4. 83 (3H, s), 5. 45 (3H, s), 6. 83 (1H, brs), 7. 33 (1H, brs), 7. 44 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 03 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 46 (1H, brs), 9. 67 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 539. 4 (MH⁺)

5 実施例 685

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 39 (9H, s), 1. 93-2. 04 (2H, m), 2. 23-2. 33 (2H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 93 (6H, s), 4. 01-4. 09 (2H, m), 4. 73 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 14 (1H, s), 7. 43 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 51 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 06 (1H, s), 8. 34-8. 39 (1H, m), 8. 86 (1H, brs), 9. 44 (1H, brs), 9. 52 (1H, brs).

実施例 686

- 15 4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 28 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 34-1. 46 (12H, m), 1. 94-2. 04 (2H, m), 2. 24-2. 32 (2H, m), 4. 00-4. 08 (2H, m), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 6. 82 (1H, brs), 7. 28-7. 36 (2H, m), 7. 42 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 9. 00-9. 08 (1H, m), 9. 32 (1H, brs), 9. 46 (1H, s).

実施例 687

- 25 4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 92-2. 05 (2H, m), 2. 23-2. 34 (2H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 01-4. 09 (2H, m), 4. 81 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 6. 83 (1H, brs), 7. 31-7. 38 (2H, m), 7. 42 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 9. 04-9. 11 (1H, m), 9. 30-9. 38 (1H, m), 9. 46 (1H, s).

5 実施例 688

4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 30 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 94-2. 05 (2H, m), 2. 24-2. 34 (2H, m), 2. 95 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 01-4. 11 (2H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 6. 82 (1H, brs), 7. 34 (1H, brs), 7. 44 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 73 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 18 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 46 (1H, brs), 9. 52-9. 60 (1H, m), 9. 82-9. 90 (1H, m).

実施例 689

15 4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 03-1. 13 (4H, m), 1. 41 (9H, s), 1. 94-2. 05 (2H, m), 2. 24-2. 38 (3H, m), 4. 01-4. 09 (2H, m), 4. 82 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 6. 83 (1H, brs), 7. 35 (1H, brs), 7. 44 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 10 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 47 (1H, brs), 9. 48-9. 56 (1H, m), 9. 62-9. 70 (1H, m).

実施例 690

25 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-3-イミノ-6-プロポキシ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 0.99 (3H, t, J=7.2Hz), 1.41 (9H, s), 1.75-1.87 (2H, m), 1.93-2.02 (2H, m), 2.24-2.32 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 4.02-4.08 (2H, m), 4.13-4.20 (2H, m), 4.83 (2H, s), 5.46 (2H, s), 6.83 (1H, brs), 7.34 (1H, brs), 7.42 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.15-8.21 (1H, m), 8.52 (1H, s), 9.18 (1H, brs), 9.46 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

実施例 691

{6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-酢酸;塩酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.26 (6H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.68-1.74 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.38-3.46 (2H, m), 4.21 (2H, s), 4.27 (2H, q, J=7.2Hz), 4.83 (2H, s), 5.35 (2H, s), 6.57 (1H, d, J=8.0Hz), 7.52 (1H, s), 7.63 (1H, d, J=8.0Hz), 7.75 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s), 9.18 (1H, brs), 9.78 (1H, brs).

- 15 MS:m/e (ESI) 493.3 (MH⁺)

実施例 692

{6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-酢酸;塩酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.26 (6H, s), 1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.39 (3H, t, J=7.2Hz), 1.68-1.74 (2H, m), 3.38-3.45 (2H, m), 4.07-4.22 (4H, m), 4.20 (2H, s), 4.77 (2H, s), 5.35 (2H, s), 6.57 (1H, d, J=8.4Hz), 7.31 (1H, s), 7.61 (1H, d, J=8.4Hz), 7.75 (1H, s), 8.99 (1H, brs), 9.33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 498.3 (MH⁺)

- 25 実施例 693

{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ

-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピペリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;
トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1. 39 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 49-1. 57 (2H, m), 1. 63-1. 70 (4H, m), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 2. 88-2. 98 (4H, m), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 85 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 63 (1H, s), 8. 23 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

実施例 694

10 {2-第3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 39 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 2. 95-3. 03 (4H, m), 3. 61-3. 68 (4H, m), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 82 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 63 (1H, s), 8. 23 (1H, q, J=5Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

実施例 695

20 {2-第3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピペリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 31 (3H, t, J=7Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 1. 50-1. 57 (2H, m), 1. 63-1. 71 (4H, m), 2. 88-2. 97 (4H, m), 4. 13 (2H, q, J=7Hz), 4. 23 (2H, q, J=7Hz), 4. 80 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 62 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

25 実施例 696

{2-第3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-酢酸;トリフルオ
ロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 31 (3H, t, J=7Hz), 1. 39 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 2. 95-3. 03 (4H, m), 3. 71-3. 78 (4
H, m), 4. 13 (2H, q, J=7Hz), 4. 23 (2H, q, J=7Hz), 4. 80 (2H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 52 (2H, s),
7. 35 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 33 (1H, brs).

実施例 697

- 10 4-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-酪酸 エチル
エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=6. 5Hz), 1. 32-1. 46 (12H, m), 1. 95-2. 08 (2H, m), 2. 57 (2H, t, J=7. 0Hz), 2
. 83 (3H, d, J=5. 0Hz), 4. 00-4. 10 (4H, m), 4. 26 (H, q, J=6. 5Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 45 (2H, s
) , 7. 40 (1H, brs), 7. 48-7. 55 (2H, m), 8. 19 (1H, 5. 0Hz), 8. 54 (1H, s).

- 15 実施例 698

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-
オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル
ボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 94-2. 08 (2H, m), 2. 28 (2H, t, J=7. 5Hz), 2. 82 (3H
, s), 3. 89 (3H, s), 4. 06 (2H, t, J=5. 5Hz), 4. 26 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 50 (2H,
s), 6. 80 (1H, brs), 7. 37 (1H, brs), 7. 48-7. 55 (3H, m), 8. 17-8. 25 (1H, m), 8. 55 (1H, s),
9. 25 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

- 25 実施例 699

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-

オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル
ボン酸 アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1. 35 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 94-2. 07 (2H, m), 2. 24-2. 31 (2H, m), 3. 90 (3H, s)
 , 4. 07 (2H, t, J=6. 5Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 6. 80 (1H, brs)
), 7. 37 (1H, brs), 7. 48-7. 54 (3H, m), 8. 63 (1H, s).

実施例 700

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-
10 オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 34 (9H, s), 1. 93-2. 08 (2H, m), 2. 24-2. 35 (2H, m), 2. 76 (3H, brs), 2. 82 (6H, s), 3. 89 (
 3H, s), 4. 03-4. 12 (2H, m), 4. 74 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 14 (1H, s), 7. 36
 (1H, brs), 7. 48-7. 56 (2H, m), 8. 07 (1H, s), 8. 31-8. 42 (1H, m), 9. 01 (1H, brs), 9. 57 (1H
 , brs).

実施例 701

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
20 ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化
水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

 1. 26 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 94-2. 07 (2H, m), 2. 27 (2H
 , t, J=6. 5Hz), 3. 88 (3H, s), 4. 02-4. 15 (4H, m), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 4
 8 (2H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 51 (1H, s).

実施例 702

25 4-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化

水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 94-2. 08 (2H, m), 2. 26 (2H, t, J=6. 5Hz), 3. 86 (3H, s), 3. 89 (3H, s), 3. 92 (3H, s), 4. 06 (2H, t, J=5. 5Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 34-7. 39 (2H, m), 7. 50 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 9. 10 (1H, brs), 9. 38 (1H, brs).

実施例 703

4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 30 (3H, t, J=7. 5Hz), 1. 35 (9H, s), 1. 94-2. 08 (2H, m), 2. 27 (2H, t, J=7. 0Hz), 2. 94 (2H, q, J=7. 5Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 06 (2H, t, J=5. 5Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 37 (1H, brs), 7. 50 (2H, brs), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 18 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 56 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

実施例 704

- 15 4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 05-1. 12 (4H, m), 1. 35 (9H, s), 1. 94-2. 07 (2H, m), 2. 23-2. 36 (3H, m), 3. 89 (3H, s), 4. 06 (2H, t, J=5. 5Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 36 (1H, brs), 7. 51 (2H, brs), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 48-9. 55 (1H, m), 9. 64-9. 72 (1H, m).

実施例 705

- 25 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 エチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 11 (3H, t, J=6.0Hz), 1. 24-1. 45 (12H, m), 1. 96-2. 07 (2H, m), 2. 22-2. 33 (2H, m), 3. 23-3. 39 (2H, m), 3. 89 (3H, s), 4. 02-4. 12 (2H, m), 4. 19-4. 30 (2H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 35 (1H, brs), 7. 51 (3H, brs), 8. 23 (1H, brs), 8. 52 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

5

実施例 706

4-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-カルボン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 54 (9H, s), 1. 62 (3H, t, J=7Hz), 3. 21 (3H, d, J=5Hz) 4. 06 (3H, s), 4. 37 (2H, q, J=7Hz), 4. 38 (3H, s), 5. 04 (2H, s), 6. 32 (2H, s), 7. 21 (1H, s), 7. 25 (1H, s), 7. 84 (1H, d, J=2Hz), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 93 (1H, d, J=2Hz), 9. 56 (1H, s), 10. 44 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 520. 0 (MH⁺)

15 実施例 707

4-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 21 (3H, t, J=7Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 2. 01-2. 09 (2H, m), 2. 48-2. 57 (2H, m), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 3. 88 (3H, s), 4. 07-4. 13 (2H, m), 4. 09 (2H, q, J=7Hz), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 25 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

実施例 708

25 4-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-酪酸 エチルエステ

ル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 20 (3H, t, J=7Hz), 1. 32 (3H, t, J=7Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 2. 00-2. 09 (2H, m), 2. 50-2. 56 (2H, m), 3. 88 (3H, s), 4. 09 (2H, q, J=7Hz), 4. 13 (2H, q, J=7Hz), 4. 23 (2H, q, J=7Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 71 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 56 (1H, s).

実施例 709

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸;トリフル
オロ酢酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 2. 78 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92 (6H, s), 4. 04-4. 10 (2H, m), 4. 72 (2H, s), 5. 32 (2H, s), 6. 57 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 14 (1H, s), 7. 73 (1H, dd, J=8. 4, 2. 0Hz), 7. 77 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 05 (1H, s), 8. 36 (1H, t, J=4. 8Hz), 8. 90-8. 94 (1H, m), 9. 45-9. 50 (1H, m).

実施例 710

- 15 5-第 3 ブチル-7-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[d]ピロロ[2, 1-b]オキサゾール-3a-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 27 (3H, J=7Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 61 (3H, t, J=7Hz), 1. 91 (1H, m), 2. 05 (1H, m), 2. 27 (1H, ddd, J=13, 7, 6Hz), 2. 72 (1H, ddd, J=13, 7, 6Hz), 3. 12 (3H, d, J=5Hz), 3. 44 (1H, ddd, J=15, 7, 6Hz), 3. 58 (1H, ddd, J=15, 7, 6Hz), 4. 23 (1H, dq, J=10, 7Hz), 4. 25 (1H, dq, J=10, 7Hz), 4. 45 (2H, brs), 4. 71 (1H, d, J=18Hz), 4. 99 (1H, d, J=18Hz), 5. 70 (1H, d, J=19Hz), 6. 46 (1H, d, J=19Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 72 (1H, s), 8. 30 (1H, q, J=5Hz), 9. 50 (1H, s), 10. 19 (1H, brs), 10. 36 (1H, brs).

- 25 MS:m/e (ESI) 563. 0 (MH⁺)

実施例 711

3-{4-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル}-プロパン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 20 (3H, t, J=7Hz), 1. 28 (3H, t, J=7Hz), 1. 57 (9H, s), 3. 03 (2H, t, J=7Hz), 3. 18 (2H, t, J=7Hz), 3. 19 (3H, d, J=5Hz), 3. 92 (3H, s), 4. 17 (2H, q, J=7Hz), 4. 37 (2H, q, J=7Hz), 5. 04 (2H, s), 6. 24 (2H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 76 (1H, s), 8. 04 (1H, q, J=5Hz), 8. 67 (1H, s), 9. 56 (1H, s), 10. 21 (1H, brs), 10. 32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 562. 0 (MH⁺)

10 実施例 712

{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 38 (9H, s), 2. 70 (6H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 66 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 9. 09 (1H, brs), 9. 31 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 502. 2 (MH⁺)

実施例 713

- 20 {2-(1-アミノ-1-メチル-エチル)-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 224 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 401 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 746 (6H, s), 2. 813 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 188 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 265 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 852 (2H, s), 5. 097 (2H, s), 5. 633 (2H, s), 7. 269 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 514 (1H, s), 7. 943 (1H, s), 8. 048 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 18-8. 24 (1H, m), 8. 560 (1H, s), 8. 587 (2H, s), 9. 658 (1H, s), 9. 999 (1H, s).

実施例 714

{2-(1-アミノ-1-メチル-エチル)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1.223 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.283 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.389 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.759 (6H, s), 4.103 (2H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 4.15-4.24 (4H, m), 4.816 (2H, s), 5.097 (2H, s), 5.676 (2H, s), 7.263 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.329 (1H, s), 7.954 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 8.034 (1H, dd, $J=2.0, 8.8\text{Hz}$), 8.668 (2H, s), 9.141 (1H, s), 9.765 (1H, s).

10 実施例 715

{2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1.31 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.38 (9H, s), 2.77 (3H, d, $J=4.4\text{Hz}$), 2.92 (6H, s), 3.70-3.82 (2H, m), 3.87 (2H, s), 4.76 (2H, s), 5.36 (1H, dd, $J=5.6, 2.0\text{Hz}$), 5.46 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.56 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.92 (1H, dd, $J=8.0, 2.4\text{Hz}$), 8.01 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 8.07 (1H, s), 8.38 (1H, q, $J=4.4\text{Hz}$), 11.69 (1H, s).

実施例 716

20 2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1.36 (9H, s), 1.42 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.93-2.02 (2H, m), 2.21-2.28 (2H, m), 3.87 (3H, s), 4.03-4.10 (2H, m), 4.28 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 6.78 (1H, brs), 7.33 (1H, brs), 7.51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.56 (1H, s), 7.70 (1H, brs), 7.78 (1H, brs), 8.62 (

1H, s).

実施例 717

4-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.28 (3H, t, J=7Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=7Hz), 1.93-2.02 (2H, m), 2.22-2.28 (2H, m), 3.87 (3H, s), 4.03-4.09 (2H, m), 4.11 (2H, q, J=7Hz), 4.21 (2H, q, J=7Hz), 4.80 (2H, s), 5.50 (2H, s), 6.78 (1H, brs), 7.32 (1H, brs), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.54 (1H, s).

10

実施例 718

2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7Hz), 1.93-2.02 (2H, m), 2.21-2.28 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=5Hz), 3.87 (3H, s), 4.03-4.10 (2H, m), 4.28 (2H, q, J=7Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 6.78 (1H, brs), 7.32 (1H, brs), 7.51 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.56 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=5Hz), 8.56 (1H, s).

20

実施例 719

[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 1.78-1.84 (1H, m), 1.97-2.05 (1H, m), 2.91 (1H, brd, J=10.4Hz), 3.04-3.09 (1H, m), 3.21-3.40 (2H, m), 4.11 (2H, q

, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.32 (2H, ABq, J=16.0Hz), 4.34 (1H, br), 4.78 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.35 (1H, s), 7.44 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 572.4 (MH⁺)

実施例 720

- 5 [2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.08-1.10 (4H, m), 1.38 (9H, s), 1.77-1.84 (1H, m), 1.99-2.06 (1H, m), 2.08-2.16 (1H, m), 2.90-2.96 (1H, m), 3.03-3.09 (1H, m), 3.29-3.40 (2H, m), 4.35 (1H, br), 4.39 (2H, ABq, J=15.6Hz), 4.82 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.37 (1H, d, J=2.0Hz), 7.45 (1H, d, J=2.4Hz), 7.72 (1H, d, J=8.0Hz), 8.10 (1H, d, J=8.0Hz), 9.47 (1H, brs), 9.66 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 507.4 (MH⁺)

実施例 721

- 15 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.94-2.01 (1H, m), 2.07-2.14 (1H, m), 2.94 (1H, brd, J=8.0Hz), 3.01-3.17 (2H, m), 3.37-3.42 (1H, m), 3.97 (2H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.25 (1H, br), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, d, J=8.0Hz), 7.32 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.70 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 572.3 (MH⁺)

実施例 722

- 25 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イル)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

ルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.08-1.10 (4H, m), 1.39 (9H, s), 1.95-2.01 (1H, m), 2.10-2.15 (1H, m), 2.28-2.33 (1H, m), 2.94 (1H, brd, J=7.6Hz), 3.01-3.06 (1H, m), 3.09-3.14 (1H, m), 3.41 (1H, br), 4.00 (2H, s), 4.27 (1H, br), 4.81 (2H, s), 4.53 (2H, d, J=6.0Hz), 7.58 (1H, s), 7.69 (1H, s), 7.71 (1H, d, J=8.0Hz), 8.09 (1H, d, J=8.4Hz).

MS:m/e (ESI) 507.3 (MH⁺)

実施例 723

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸
エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.00-1.14 (4H, m), 1.17 (3H, d, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.80-1.97 (4H, m), 1.99-2.12 (2H, m), 2.26-2.37 (1H, m), 2.43-2.55 (2H and DMSO, m), 3.05-3.18 (4H, m), 3.75-3.93 (2H, m), 4.05 (2H, q, J=6.8Hz), 4.81 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.71 (1H, d, J=8.0Hz), 8.09 (1H, d, J=8.0Hz), 9.46 (1H, brs), 9.65 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 547.4 (MH⁺)

実施例 724

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペン
タン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.05-1.14 (4H, m), 1.16 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.63-2.00 (8H, m), 2.27-2.42 (3H, m), 3.06-3.19 (4H, m), 3.75-3.93 (2H, m), 4.04 (2H, q, J=6.8Hz), 4.81 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.71 (1H, d, J=8.0Hz), 8.09 (1H, d, J=8.0Hz), 9.45 (1H, brs), 9.65 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 561. 4 (MH⁺)

実施例 725

4-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 17 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 82-1. 96 (4H, m), 1. 99-2. 11 (2H, m), 2. 44-2. 55 (2H and DMSO, m), 3. 05-3. 18 (4H, m), 3. 78-3. 91 (5H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 05 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 45 (1H, s).

10

MS:m/e (ESI) 584. 3 (MH⁺)

実施例 726

5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 62-1. 99 (8H, m), 2. 32-2. 43 (2H, m), 3. 03-3. 20 (4H, m), 3. 77-3. 92 (5H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 04 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 36 (2H, s), 7. 45 (1H, s), 9. 08 (1H, brs), 9. 29 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 598. 4 (MH⁺)

20

実施例 727

4-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25

1. 17 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 04-2. 08 (2H, m), 2. 48-2. 53 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 04-4. 12 (4H, m), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz)

), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.50-7.56 (2H, m), 8.21 (1H, d, J=5.2Hz), 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 568.3 (MH⁺)

実施例 728

5 4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.17 (3H, t, J=7.2Hz), 1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 2.03-2.08 (2H, m), 2.47-2.53 (2H, m), 3.88 (3H, s), 4.04-4.14 (6H, m), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.80 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, d, J=2.0Hz), 7.52 (1H, d, J=2.0Hz)

MS:m/e (ESI) 573.3 (MH⁺)

実施例 729

15 4-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.17 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 2.05-2.08 (2H, m), 2.45-2.54 (2H, m), 3.87 (3H, s), 3.89 (3H, s), 3.96 (3H, s), 4.04-4.12 (4H, m), 4.81 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.48-7.54 (2H, m).

MS:m/e (ESI) 545.3 (MH⁺)

実施例 730

25 4-{8-第3ブチル-6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 78-1. 85 (2H, m), 2. 38 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 77 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 32-3. 38 (4H, m), 4. 04 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 23-4. 28 (2H, m), 4. 74 (1H, s), 5. 44 (1H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 22 (2H, s), 8. 08 (1H, s), 8. 38 (1H, d, J=4. 8 Hz).

5 MS:m/e (ESI) 578. 4 (MH⁺)

実施例 731

4-{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 15 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 78-1. 84 (2H, m), 2. 38 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 30-3. 38 (4H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 98 (3H, s), 4. 04 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 23-4. 28 (2H, m), 4. 80 (1H, s), 5. 47 (1H, s), 7. 21 (2H, s), 7. 36 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 556. 3 (MH⁺)

15 実施例 732

4-({3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-メチル-アミノ)-酪酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 16 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 65 (2H, quint, J=7. 2Hz), 2. 36 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 56 (3H, s), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 91 (1H, t, J=7. 2Hz), 4. 03 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 7. 77 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 22 (1H, s), 9. 86 (1H, s).

実施例 733

25 2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-{[3-(ヒドロキシメチル-カルバモイル)-プロピル]-メチル-アミノ}-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ

-2, 3-ジヒドロ-1H-インドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 62 (2H, quint, J=7. 2Hz), 2. 10 (2H, t, J=7. 2Hz),
2. 57 (3H, s), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 87 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 29 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 47
5 (2H, t, J=6. 0Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 46 (2H, d), 5. 51 (1H, t, J=6. 0Hz) 7. 55 (1H, s), 7. 68 (1
H, s), 7. 75 (1H, s), 8. 23 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 46 (1H, t, J=6. 0Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 17 (1H
, s), 9. 83 (1H, s).

実施例 734

10 2-[2-(7-第 3 ブチル-2-メチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-オキシ-エチ
ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-インドル-5-カルボン酸メチ
ルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 49 (9H, s), 2. 72 (3H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 30 (2H, q, J=
6. 8Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 61 (2H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 85 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 23 (1H, q, J=4
15 . 4Hz), 8. 28 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 59 (1H, s), 9. 26 (1H, s), 9. 89 (1H, s).

実施例 735

{5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-インドル
ル-2-イル)-アセチル]-1, 3, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インドル-2-イ
ル}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 072 (6H, s) 1. 202 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 401 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 57-2. 74 (2H, m), 2. 815
(3H, d, J=4. 8Hz), 3. 608 (1H, t, J=6. 4Hz), 4. 116 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 265 (2H, d, J=6. 8H
z), 4. 830 (2H, s), 5. 381 (2H, s), 6. 608 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 516 (1H, s), 7. 612 (1H, d, J=
1. 6Hz), 7. 785 (1H, dd, J=1. 6, 8. 4Hz), 8. 213 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 537 (1H, s), 9. 224 (1H
25 , s), 9. 814 (1H, s).

実施例 736

, brs), 8.56 (1H, br), 9.36 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 595.5 (MH⁺)

実施例 739

5 [2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.08-1.10 (4H, m), 1.23 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.77-1.84 (1H, m), 1.97-2.05 (1H, m), 2.29-2.35 (1H, m), 2.93 (1H, brd, J=10.0Hz), 3.02-3.09 (1H, m), 3.26-3.42 (2H, m), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.33 (1H, brs), 4.49 (2H, ABq, J=15.6Hz), 4.82 (2H, s), 5.81 (2H, s), 7.40 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=8.4Hz), 8.09 (1H, d, J=8.4Hz), 9.60 (1H, br), 9.67 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 535.3 (MH⁺)

実施例 740

15 [2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドル-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.19 (3Ht, J=6.8Hz), 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, brs), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.93-2.02 (1H, m), 2.10-2.19 (1H, m), 2.92 (1H, dd, J=4.0, 10.0Hz), 2.99-3.04 (1H, m), 3.12 (1H, dd, J=7.6, 15.6Hz), 3.44 (1H, dd, J=6.4, 10.0Hz), 4.01 (1H, q, J=6.8Hz), 4.12 (2H, q, J=6.8Hz), 4.15 (2H, s), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.28 (1H, br), 4.78 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.59 (1H, s), 7.63 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 600.5 (MH⁺)

25 実施例 741

(1-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ

ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン
-3-イルオキシ)-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 18 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 94-2. 02 (1H, m), 2. 11-2. 18 (1H, m), 2. 82 (3H, d, J=3. 6Hz), 2. 94-2. 98 (1H, m), 3. 03-3. 09 (1H, m), 3. 12-3. 19 (1H, m), 3. 45-3. 49 (1H, m), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 16 (2H, s), 4. 25 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 62 (1H, s), 7. 66 (1H, s), 8. 21 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 38 (1H, br), 9. 93 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 595. 4 (MH⁺)

10 実施例 742

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イ
ルオキシ)-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 18 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 96-2. 03 (1H, m), 2. 12-2. 17 (1H, m), 2. 28-2. 34 (1H, m), 2. 98 (1H, brd, J=9. 2Hz), 3. 06-3. 11 (1H, m), 3. 13-3. 19 (1H, m), 3. 49 (1H, dd, J=5. 2, 9. 6Hz), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 16 (2H, s), 4. 30 (1H, brs), 4. 82 (2H, s), 5. 58 (2H, s), 7. 62 (1H, s), 7. 67 (1H, s), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 61 (1H, brs), 9. 66 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 535. 3 (MH⁺)

実施例 743

2,2-ジメチル-プロピオン酸 2-{2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチ
ルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジ
ン-1-イル)-フェノキシ}-アセトキシメチルエステル;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 15 (9H, s), 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 84-1. 89 (4H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8

Hz), 3.06-3.12 (4H, m), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.58 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.49 (2H, s), 5.83 (2H, s), 7.43 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s), 9.15 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 665.4 (MH⁺)

5 実施例 744

2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(1,2,3,3-テトラメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.02 (3H, s), 1.14 (3H, d, J=6.4Hz), 1.21-1.30 (9H, m), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.79 (3H, s), 3.10-3.20 (1H, m), 4.10 (2H, q, J=6.8Hz), 4.19 (2H, q, J=6.8Hz), 4.76 (2H, s), 5.33 (2H, s), 6.59 (1H, d, J=8.4Hz), 7.31 (1H, s), 7.60 (1H, s), 7.75 (1H, d, J=8.4Hz).

MS:m/e (ESI) 454.2 (MH⁺)

実施例 745

- 15 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-酢酸 エチルエス
テル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.27 (3H, t, J=7Hz), 1.31 (3H, t, J=7Hz), 1.39 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.95-3.01 (4H, m), 3.69-3.77 (4H, m), 4.13 (2H, q, J=7Hz), 4.23 (2H, q, J=7Hz), 4.25 (2H, q, J=7Hz), 4.81 (2H, s), 4.92 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.66 (1H, s), 9.08 (1H, brs), 9.33 (1H, brs).

実施例 746

- 25 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 86-1. 96 (1H, m), 2. 02-2. 12 (1H, m), 2. 89-2. 95 (1H, m), 3. 01-3. 18 (2H, m), 3. 36-3. 42 (1H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 3. 99 (2H, brs), 4. 23-4. 27 (1H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 47 (2H, d, J=7. 2Hz), 7. 35 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 70 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 544. 4 (MH⁺)

実施例 747

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 19 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 96-2. 02 (1H, m), 2. 11-2. 19 (1H, m), 2. 94-2. 97 (1H, m), 3. 02-3. 09 (1H, m), 3. 12-3. 18 (1H, m), 3. 47 (1H, dd, J=6. 0, 10. 4Hz), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 27-4. 32 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 60 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 9. 09 (1H, s), 9. 45 (1H, s).

15 MS:m/e (ESI) 572. 3 (MH⁺)

実施例 748

3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-プロパン酸 メチルエステル;塩酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 41 (9H, s), 2. 84 (2H, t, J=7. 2Hz), 3. 19-3. 27 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 31 (2H, brs), 4. 80 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 86 (1H, s), 8. 10 (1H, s), 9. 08 (1H, s), 9. 13-9. 17 (1H, m), 9. 45 (1H, s), 10. 20 (1H, s).

25 MS:m/e (ESI) 544. 3 (MH⁺)

実施例 749

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 88-1. 98 (1H, m), 2. 13-2. 21 (2H, m), 2. 28-2. 38 (1H, m), 3. 78-3. 84 (1H, m), 4. 12 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 20 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 23 (1H, brs), 4. 71 (1H, d, J=14.4Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 7. 73 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 570. 4 (MH⁺)

10 実施例 750

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸 メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 02-2. 09 (1H, m), 2. 32-2. 45 (3H, m), 3. 64 (3H, s), 4. 12 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 20 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 29 (1H, d, J=17.6Hz), 4. 39-4. 45 (1H, m), 4. 63 (1H, d, J=14.4Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 49 (2H, d, J=8.4Hz), 7. 33 (1H, s), 7. 72 (1H, s), 7. 78 (1H, s), 9. 06 (1H, s), 9. 46 (1H, s), 10. 03 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 584. 3 (MH⁺)

20 実施例 751

(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 35 (9H, s), 1. 96 (3H, s), 2. 49 (2H, s), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 39 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 76 (1H, s), 7. 88 (1H, s), 8. 31 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 530. 2 (MH⁺)

実施例 752

(4-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 32 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 35-2. 55 (8H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 0Hz), 3. 18 (2H, s), 3. 56 (2H, s), 4. 05 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 67 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 7. 87 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4. 0), 8. 56 (1H, s), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 592. 5 (MH⁺)

実施例 753

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-メトキシカルボニルイミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 41 (9H, s), 1. 55 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 88-1. 95 (4H, m), 3. 01 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 08-3. 25 (4H, m), 3. 85 (3H, s), 4. 19-4. 35 (4H, m), 4. 51 (2H, s), 4. 62 (2H, s), 5. 10 (2H, s), 6. 99 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 64-7. 73 (1H, m), 8. 81 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 637. 4 (MH⁺)

実施例 754

2-[2-(7-第 3 ブチル-2-メトキシメチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 45 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 50 (9H, s), 2. 86 (3H, d, J=4.4Hz), 3. 47 (3H, s), 4. 31 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 82 (2H, s), 4. 92 (2H, s), 5. 63 (2H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 91 (1H, d, J=1.6Hz), 8. 23 (1H, m), 8. 39 (1H, d, J=1.6Hz), 8. 61 (1H, s), 9. 30 (1H, m), 9. 92 (1H, m).

実施例 755

- 5 7-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾオキサゾール e-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 10 1. 40 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 44 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 52 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=4.4Hz), 4. 29 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 49 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 92 (2H, s), 5. 63 (2H, s), 7. 57 (1H, s), 8. 02 (1H, s), 8. 24 (1H, q, J=4.4Hz), 8. 57 (1H, s), 8. 60 (1H, s), 9. 28 (1H, s), 9. 91 (1H, s).

実施例 756

- 15 {3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジルオキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 20 1. 33 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7.2Hz), 2. 82 (2H, d, J=4.8), 4. 13 (2H, s), 4. 26 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 64 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 7. 82 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4.8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 24 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

実施例 757

- 25 2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 42 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7.2Hz), 2. 11 (2H, m), 2. 85 (3H, d, J=4.4Hz), 4. 12 (2H, t, J=5.6Hz), 4. 30 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 55 (2H, s), 8.

22 (1H, m), 8.59 (1H, s), 9.21 (1H, m), 9.86 (1H, m).

実施例 758

2-(2-{3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-[3-(2-メトキシ-エトキシ)-プロポキシ]-
フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.45 (9H, s), 1.53 (3H, t, J=7.2Hz), 2.11 (2H, m), 3.30 (3H, s), 3.54 (2H, m), 3.61 (2H, m), 3.69 (2H, t, J=7.2Hz), 4.22 (4H, m), 4.36 (2H, q, J=7.2Hz), 4.90 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.48 (1H, sz), 7.52 (1H, s), 7.67 (1H, s), 8.54 (1H, s).

10 実施例 759

{4-[2-(1-アセトキシメトキシカルボニルイミノ-5-エトキシ-6-メチルカルバモ
イル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-第 3 ブチル-6-(ピロ
リジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.33 (3H, t, J=7.2Hz), 1.42 (9H, s), 1.55 (3H, t, J=7.2Hz), 1.87-1.97 (4H, m), 2.15 (3H, s), 3.00 (3H, d, J=4.8Hz), 3.11-3.22 (4H, m), 4.18-4.36 (4H, m), 4.51 (2H, s), 4.64 (2H, s), 5.14 (2H, s), 5.88 (2H, s), 6.99 (1H, s), 7.44 (1H, s), 7.50-7.65 (2H, m), 8.88 (1H, s).

実施例 760

20 1-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-カ
ルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.10 (3H, t, J=7Hz), 1.41 (9H, s), 1.54 (3H, t, J=7Hz), 1.91-2.13 (3H, m), 2.45 (1H, q, J=7Hz), 3.13 (3H, d, J=5Hz), 3.32 (1H, br. t, J=7Hz), 3.74 (1H, br. t, J=7Hz), 3.75 (3H, s), 4.01 (1H, qd, J=7, 2Hz), 4.02 (1H, qd, J=7, 2Hz), 4.46 (2H, brs), 4.58 (1H, t, J=7Hz),

4. 86 (2H, s), 6. 12 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 61 (1H, d, J=2Hz), 7. 66 (1H, d, J=2Hz), 8. 30 (1H, m), 9. 50 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 579. 0 (MH⁺)

実施例 761

- 5 1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 24 (6H, t, J=7Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 53 (3H, t, J=7Hz), 1. 92-2. 12 (3H, m), 2. 42-2. 49 (1H,), 3. 35 (1H, t, J=6Hz), 3. 71 (1H, t, J=6Hz), 3. 73 (3H, s), 4. 01 (2H, m), 4. 18 (4H, q, J=7Hz), 4. 60 (1H, t, J=6Hz), 4. 77 (2H, s), 6. 09 (2H, s), 6. 85 (1H, s), 7. 62 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 584. 0 (MH⁺)

実施例 762

- 15 1-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 11 (3H, t, J=7Hz), 1. 15-1. 25 (4H, m), 1. 40 (9H, s), 1. 92-2. 11 (4H, m), 2. 15-2. 21 (1H, m), 2. 41-2. 49 (1H, m), 3. 35 (1H, t, J=7Hz), 3. 71 (1H, t, J=7Hz), 3. 73 (3H, s), 4. 01 (1H, qd, J=7, 4Hz), 4. 02 (1H, qd, qd, J=7, 4Hz), 4. 60 (1H, t, J=7Hz), 4. 82 (2H, s), 6. 20 (2H, s), 7. 54 (1H, d, J=8Hz), 7. 63 (1H, d, J=2Hz), 7. 64 (1H, d, J=2Hz), 7. 79 (1H, d, J=8Hz).

MS:m/e (ESI) 519. 0 (MH⁺)

実施例 763

- 25 {4-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 24 (3H, t, 7Hz), 1. 41 (3H, t, J=7Hz), 1. 57 (9H, s), 2. 84 (3H, d, J=5Hz), 4. 19 (2H, q, J=7H), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 89 (2H, s), 5. 37 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 71 (1H, d, =2Hz), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 26 (1H, d, J=2Hz), 8. 44 (1H, s), 8. 57 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 534. 0 (MH⁺)

実施例 764

{4-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸 エチルエス
テル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 21 (3H, t, J=7Hz), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 1. 55 (3H, t, J=7Hz), 1. 60 (9H, s), 4. 18-4. 25 (4H, m), 4. 23 (2H, q, J=7Hz), 5. 02 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 6. 14 (2H, s), 6. 90 (1H, s), 7. 00 (1H, s), 7. 98 (1H, s), 8. 54 (1H, brs), 8. 99 (1H, brs), 10. 78 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 539. 0 (MH⁺)

15 実施例 765

{4-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸 エチルエス
テル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 12-1. 24 (4H, m), 1. 35 (3H, t, J=7Hz), 1. 60 (9H, s), 2. 17-2. 24 (1H, m), 4. 32 (2H, q, J=7Hz), 5. 05 (2H, s), 5. 29 (2H, s), 6. 23 (2H, s), 7. 31 (1H, brs), 7. 37 (1H, d, J=8Hz), 7. 82 (1H, d, J=2Hz), 7. 84 (1H, d, J=8Hz), 8. 08 (1H, s), 8. 85 (1H, d, J=2Hz).

MS:m/e (ESI) 474. 0 (MH⁺)

実施例 766

25 2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシ-フェニル]-2-
オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル

-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 95-2. 04 (2H, m), 2. 23-2. 30 (2H, m), 2. 79 (3H, d, J=5Hz), 2. 93 (6H, s), 3. 89 (2H, s), 4. 05-4. 11 (2H, m), 4. 76 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 17 (1H, s), 7. 34 (1H, brs), 7. 52 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 8. 09 (1H, s), 8. 38 (1H, q, J=5Hz).

実施例 767

2-{2-[7-第3ブチル-2-(2-シアノ-エチル)-ベンゾオキサゾール-5-イル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 50 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 12 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 45 (2H, t, J=6. 4Hz), 4. 31 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 61 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 88 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 23 (1H, m), 8. 37 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 60 (1H, s), 9. 28 (1H, m), 9. 90 (1H, m).

- 15 実施例 768

2-{2-[7-第3ブチル-2-(2-カルバモイル-エチル)-ベンゾオキサゾール-5-イル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 49 (9H, s), 2. 71 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 23 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 60 (2H, s), 6. 93 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 84 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 23 (1H, m), 8. 28 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 60 (1H, s), 9. 28 (1H, m), 9. 91 (1H, m).

実施例 769

- 25 3-{7-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-アセチル}-ベンゾオキサゾール-2-イル}-プロパン

酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 49 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 88 (2H, t, J=7. 6Hz), 3. 27 (2H, t, J=7. 6Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 85 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 23 (1H, m), 8. 31 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 60 (1H, s), 9. 28 (1H, m), 9. 90 (1H, m).

実施例 770

- 10 2-{2-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(3-メチルカルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 41 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 1. 97-2. 06 (2H, m), 2. 26-2. 35 (2H, m), 2. 58 (3H, d, J=5Hz), 2. 84 (3H, d, J=5Hz), 4. 03-4. 10 (2H, m), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 72 (1H, q, J=5Hz), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 57 (1H, s).

実施例 771

- 20 2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-ジメチルカルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 96-2. 06 (2H, m), 2. 52-2. 59 (2H, m), 2. 83 (3H, s), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 2. 98 (3H, s), 4. 06-4. 14 (2H, m), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

実施例 772

- 25 2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(3-メチルカルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 38 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 98-2. 08 (2H, m), 2. 26-2. 33 (2H, m), 2. 57 (3H, d, J=5Hz), 2. 84 (3H, d, J=5Hz), 3. 92 (3H, s), 4. 05-4. 12 (2H, m), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 56 (2H, s), 7. 78-7. 88 (1H, m), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

実施例 773

2-[2-[3-第3ブチル-5-(3-ジメチルカルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 1. 98-2. 08 (2H, m), 2. 45-2. 56 (2H, m), 2. 83 (3H, s), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 2. 98 (3H, s), 3. 92 (3H, s), 4. 08-4. 16 (2H, m), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 55 (3H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

15

実施例 774

2-[2-(7-第3ブチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 50 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 31 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 62 (2H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 93 (1H, s), 8. 23 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 45 (1H, s), 8. 59 (1H, s), 8. 98 (1H, s), 9. 26 (1H, s), 9. 90 (1H, s).

実施例 775

{5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-7-メトキシ-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (6H, s), 1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 76 (3H, s), 4. 27 (2H, s), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 39 (2H, s), 7. 32 (1H, d, J=1. 2Hz), 7. 42 (1H, d, J=1. 2Hz), 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, m), 8. 58 (1H, s), 9. 21 (1H, m), 9. 83 (1H, m).

5 実施例 776

2-{2-[3-(3-カルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 1. 90-2. 01 (2H, m), 2. 21-2. 28 (2H, m), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 4. 03-4. 10 (2H, m), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 03 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 29-7. 37 (2H, m), 7. 48-7. 57 (3H, m), 7. 49-7. 54 (1H, m), 8. 23 (1H, q, J=5Hz), 8. 59 (1H, s).

実施例 777

15 {2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-インドル-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 40 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 88 (3H, s), 3. 77 (3H, s), 3. 99 (2H, s), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 32 (2H, s), 7. 38 (1H, dd, J=7. 2, 1. 6Hz), 7. 60 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 45 (1H, s).

実施例 778

25 ((2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-インドル-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニル)-メチル-アミノ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (3H, t, J=6. 4Hz), 1. 44 (9H, s), 2. 67 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 28 (1H, d, J=20Hz) 4. 05 (1H, d, J=20Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 4Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 47 (1H, d, J=2. 0Hz) 7. 54 (1H, s), 7. 58 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 16-9. 20 (1H, m), 9. 83-9. 88 (1H, m).

5 実施例 779

2-[2-(7-第3ブチル-3-シアノメチル-3H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-オキシノ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

10 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 1. 57 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=4Hz), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 5. 74 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 78 (1H, d, J=1Hz), 8. 22 (1H, q, J=4Hz), 8. 39 (1H, d, J=1Hz), 8. 56 (1H, s), 8. 59 (1H, s), 9. 28 (1H, s), 9. 48 (1H, s).

MS:m/e(ESI) 487. 0 (MH⁺)

実施例 780

15 {4-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

20 1. 30 (3H, t, J=7Hz), 1. 40 (3H, t, J=7Hz), 1. 55 (9H, s), 4. 13 (2H, q, J=7Hz), 4. 22 (2H, q, J=7Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 48 (2H, s) 5. 75 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 77 (1H, d, J=2Hz), 8. 37 (1H, d, J=2Hz), 8. 56 (1H, s).

MS:m/e(ESI) 492. 0 (MH⁺)

実施例 781

25 {4-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 05-1. 16 (4H, m), 1. 56 (9H, s), 2. 30-2. 37 (1H, m), 4. 89 (2H, s), 5. 65 (2H, s), 5. 74 (2H, s), 7. 74 (1H, d, J=8Hz), 7. 78 (1H, d, J=2Hz), 8. 12 (1H, d, J=8Hz), 8. 39 (1H, d, J=2Hz), 8. 57 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 427. 0 (MH⁺)

実施例 782

2-{2-[3-アセチルアミノ-5-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36-1. 43 (12H, s), 2. 01-2. 07 (2H, m), 2. 13 (3H, s) 2. 27 (2H, t, J=7. 2), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz) 3. 87 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 28 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 6. 86 (1H, s), 7. 38 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=2. 0), 8. 17-8. 23 (2H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 65 (1H, s), 9. 83 (1H, s).

15 MS:m/e (ESI) 566. 3 (MH⁺)

実施例 783

2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-シアノ-プロポキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 17 (2H, m), 2. 73 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 23 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 22 (1H, d, J=9. 2Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 87 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 94 (1H, dd, J=2. 0, 9. 2Hz), 8. 22 (1H, m), 8. 59 (1H, s).

25 実施例 784

2-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキ

シ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 99 (6H, s), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 06 (1H, s), 7. 12 (1H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 23 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 24 (1H, s), 9. 85 (1H, s).

実施例 785

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20-1. 50 (12H, m), 1. 93-2. 07 (1H, m), 2. 10-2. 23 (1H, m), 2. 77 (3H, d, J=5. 1Hz), 2. 94-3. 05 (1H, m), 3. 06-3. 24 (2H, m), 3. 43-3. 54 (1H, m), 4. 07 (3H, s), 4. 14-4. 55 (5H, m), 4. 87 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 52-8. 62 (1H, s), 9. 54 (1H, brs), 9. 95 (1H, brs).

実施例 786

3-(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-プロパン酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 23-1. 46 (12H, m), 2. 16 (3H, s), 2. 60-2. 83 (5H, m), 3. 51-3. 69 (2H, m), 4. 15-4. 32 (2H, m), 4. 48 (2H, brs), 4. 88 (2H, brs), 5. 57 (2H, brs), 7. 81 (1H, s), 7. 93 (2H, brs), 7. 99 (1H, brs), 8. 55-8. 64 (1H, m), 9. 97 (1H, brs).

実施例 787

4-[2-第3ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ペピリジン-1-イルメチル)-フェノキシ]-ブ

チルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 73 (4H, br), 2. 02 (2H, br), 2. 27 (2H, t, J=7. 6Hz), 2. 58 (3H, s), 3. 14 (2H, br), 3. 24-3. 40 (2H, br), 3. 83 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 53 (2H, s), 4. 60 (2H, s), 5. 15 (2H, s), 6. 81 (1H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 46 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 56 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 87 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 95 (1H, d, J=8. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 534. 3 (MH⁺)

実施例 788

2-[2-(7-第 3 ブチル-3H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 54 (9H, s), 2. 74 (3H, d, J=5Hz), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 70 (1H, s), 8. 16 (1H, brs), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 45 (1H, s), 8. 57 (1H, s), 9. 23 (1H, s), 9. 45 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 448. 0 (MH⁺)

実施例 789

2-[2-(7-第 3 ブチル-3-メチル-3H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (3H, t, J=7Hz), 1. 55 (9H, s), 2. 74 (3H, d, J=4Hz), 3. 94 (3H, s), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 89 (2H, s), 5. 60 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4Hz), 8. 23 (1H, s), 8. 42 (1H, s), 8. 58 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 462. 0 (MH⁺)

実施例 790

2-[2-(7-第3ブチル-3-カルバモイルメチル-3H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.42 (3H, t, J=7Hz), 1.58 (9H, s), 2.83 (3H, d, J=5Hz), 4.29 (2H, q, J=7Hz), 4.89 (2H, s), 5.13 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.38 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.70 (1H, d, J=2Hz), 7.82 (1H, s), 8.12 (1H, d, J=2Hz), 8.22 (1H, q, J=5Hz), 8.39 (1H, s), 8.58 (1H, s), 9.26 (1H, d, J=4Hz), 9.85 (1H, d, J=4Hz).

MS:m/e (ESI) 505.0 (MH⁺)

10 実施例 791

2-{4-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.28 (3H, t, J=7Hz), 1.40 (3H, t, J=7Hz), 1.56 (9H, s), 4.12 (2H, q, J=7Hz), 4.22 (2H, q, J=7Hz), 4.84 (2H, s), 5.03 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.67 (1H, s), 7.82 (1H, s), 8.10 (1H, s), 8.39 (1H, s), 9.04 (1H, brs), 9.39 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 510.0 (MH⁺)

実施例 792

- 20 2-{4-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.05-1.13 (4H, m), 2.33 (1H, quint, J=7Hz), 1.57 (9H, s), 4.86 (2H, s), 5.03 (2H, s), 5.62 (2H, s), 7.38 (1H, s), 7.70 (1H, s), 7.73 (1H, d, J=8Hz), 7.81 (1H, s), 8.10 (1H, d, J=8Hz), 8.11 (1, s), 8.39 (1H, s), 9.53 (1H, brs), 9.66 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 445.0 (MH⁺)

実施例 793

5 2-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (12H, m), 2.63 (6H, s), 2.84 (2H, s), 4.30 (2H, q, J=6.8Hz), 4.86 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.56 (1H, s), 7.66 (1H, s), 7.71 (1H, s), 8.22 (1H, s), 8.57 (1H, s), 9.17 (1H, s), 9.84 (1H, s).

10 実施例 794

4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.01-1.15 (4H, m), 1.37 (9H, s), 1.82-2.08 (6H, m), 2.28-2.43 (3H, m), 2.82-3.42 (4H, m), 3.78-3.94 (2H, m), 4.81 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.68-7.75 (1H, m), 8.06-8.12 (1H, m), 9.44 (1H, brs), 9.66 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 519.3 (MH⁺)

実施例 795

20 5-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.00-1.15 (4H, m), 1.38 (9H, s), 1.59-1.85 (4H, m), 2.23-2.37 (3H, m), 3.03-3.20 (4H, m), 3.78-3.88 (2H, m), 4.81 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=8.0Hz), 8.09 (1H, d, J=8.0Hz), 9.41-9.49 (1H, m), 9.61-9.70 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 533. 3 (MH⁺)

実施例 796

4-{4-[2-(1-アミノ-7-フルオロ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-第 3 ブチル-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸;
5 トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 79-1. 96 (4H, m), 2. 01 (2H, t, J=6. 8Hz), 2. 41 (2H, t, J=7. 2Hz), 3. 02-3. 20 (4H, m), 3. 77-3. 90 (5H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 35 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 36 (1H, s), 7. 45 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 03-9. 11 (1H, m), 9. 27-9. 34 (1H, m).

10 実施例 797

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタ
ン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 38 (9H, s), 1. 55-1. 99 (8H, m), 2. 17-2. 36 (2H, m), 2. 94-3. 20 (4H, m), 3. 57-4. 27 (8H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 36 (2H, s), 7. 45 (1H, s), 9. 01-9. 11 (1H, m), 9. 22-9. 35 (1H, m).

実施例 798

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 41 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 13 (2H, m), 2. 75 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 80 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 11-4. 19 (4H, m), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 76 (2H, m), 7. 59 (1H, s), 8. 22 (1H, m), 8. 59 (1H, s), 9. 21 (1H, m).

実施例 799

2,6-ジ第3ブチル-4-[1-ヒドロキシ-2-(3-イミノ-5,6-ジメトキシ-3H-ベンゾ[d]イソキサゾール-2-イル)-ビニル]-フェノール;臭化水素酸塩

⁵ 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 45 (18H, s), 3. 90 (3H, s), 4. 07 (3H, s), 5. 96 (1H, s), 6. 27 (1H, brs), 6. 52 (1H, s), 7. 84 (1H, s), 7. 98 (2H, s), 9. 55-9. 66 (2H, m), 9. 80 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 441. 1 (MH⁺)

実施例 800

¹⁰ 2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-オキシノ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 41 (12H, m), 1. 94 (4H, s), 2. 84 (3H, s), 3. 02 (4H, s), 4. 30 (2H, q, 6. 4Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 62 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 8. 23 (1H, s), 8. 57 (1H, s), 9. 18 (1H, s), 9. 84 (1H, s).

¹⁵ 実施例 801

({3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

²⁰ 1. 32 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 06 (3H, s), 4. 21 (2H, s), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 01 (1H, s), 7. 07 (1H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 33 (1H, s), 9. 89 (1H, s).

実施例 802

²⁵ ({3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 18 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 32 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 08 (3H, s), 4. 10 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 32 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 00 (1H, s), 7. 08 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 23 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 30 (1H, s), 9. 88 (1H, s).

5 実施例 803

4-{3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチルアミド; 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 38 (9H, s), 1. 95-2. 05 (2H, m), 2. 28 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 57 (3H, s), 4. 04-4. 10 (2H, m), 4. 68 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 03 (1H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 28 (1H, s), 7. 44 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 52 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 19 (1H, s), 9. 45-9. 51 (1H, m), 9. 84-9. 90 (1H, m).

実施例 804

15 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 38 (9H, s), 1. 85-1. 92 (4H, m), 2. 01 (2H, m), 2. 40 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 57 (3H, s), 3. 08-3. 15 (4H, m), 3. 85 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 69 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 5. 67 (1H, s), 7. 36 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 46 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 20 (1H, s).

実施例 805

25 4-({2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酪酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.04-1.12 (4H, m), 1.42 (9H, s), 1.70-1.82 (2H, m), 2.44 (2H, t, J=7.6Hz), 2.52 (3H, s), 2.70-2.80 (2H, m), 4.83 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.58 (1H, d, J=8.0Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0Hz), 7.90 (1H, dd, J=8.4, 2.0Hz), 7.94 (1H, d, J=2.0Hz), 8.09 (1H, dd, J=8.4Hz), 9.44-9.50 (1H, m), 9.63-9.68 (1H, m).

5 実施例 806

4-({2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.40 (3H, t, J=7.2Hz), 1.43 (9H, s), 1.70-1.82 (2H, m), 2.24 (3H, t, J=6.8Hz), 2.51 (3H, s), 2.70-2.80 (2H, m), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=7.2Hz), 4.80 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.57 (1H, d, J=8.4Hz), 7.88 (1H, d, J=8.4Hz), 7.93 (1H, s), 9.04 (1H, brs), 9.29 (1H, brs).

実施例 807

- 15 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-イミノ-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロインドール-1-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.48 (18H, s), 1.60 (6H, m), 5.77 (2H, s), 7.27 (1H, t, J=7.2Hz), 7.35 (1H, t, J=7.2Hz), 7.40 (1H, d, J=7.2Hz), 7.54 (1H, d, J=7.2Hz), 7.58 (2H, s), 8.10 (1H, brs), 9.88 (1H, brs), 10.04 (1H, brs).

実施例 808

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.39 (12H, m), 2.77 (6H, s), 2.84 (3H, s), 3.85 (3H, s), 4.30 (2H, q, J=7.2Hz), 4.86 (2H,

s), 5.52 (2H, s), 7.48 (1H, s), 7.56 (2H, s), 8.22 (1H, s), 8.57 (1H, s), 9.18 (1H, s), 9.85 (1H, s).

実施例 809

5 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.17 (3H, t, J=7.2Hz), 1.37 (9H, s), 1.65-1.83 (4H, m), 2.05-2.19 (2H, m), 2.39 (2H, t, J=6.6Hz), 2.69 (2H, t, J=6.8Hz), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.00-4.19 (6H, m), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.52 (1H, s), 7.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 612.3 (MH⁺)

実施例 810

15 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.17 (3H, t, J=7.0Hz), 1.28-1.44 (12H, m), 1.67-1.84 (4H, m), 2.06-2.17 (2H, m), 2.39 (2H, t, J=6.8Hz), 2.69 (2H, t, J=7.0Hz), 2.77 (3H, d, J=3.6Hz), 3.99-4.18 (6H, m), 4.24 (2H, t, J=6.8Hz), 4.88 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.56 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.47-8.58 (1H, m), 9.44 (1H, brs), 9.96 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 636.3 (MH⁺)

実施例 811

25 4-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 25-1. 47 (12H, m), 1. 88 (4H, brs), 1. 98-2. 10 (2H, m), 2. 42-2. 55 (2H, m), 2. 77 (3H, brs), 3. 11 (4H, brs), 3. 65-3. 88 (2H, m), 4. 05 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 24 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 45 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 50-8. 58 (1H, m), 9. 44 (1H, brs), 9. 94 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 608. 3 (MH⁺)

実施例 812

5-(2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;塩酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 26-1. 45 (12H, m), 1. 62-1. 85 (4H, m), 1. 88 (4H, brs), 2. 37 (2H, t, J=6.8Hz), 2. 77 (3H, brs), 3. 12 (4H, brs), 3. 78-3. 91 (2H, m), 3. 95-4. 10 (2H, m), 4. 12-4. 32 (2H, m), 4. 87 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 36 (1H, brs), 7. 46 (1H, brs), 7. 99 (1H, s), 8. 53 (1H, q, J=4.4Hz) 9. 35-9. 46 (1H, m), 9. 92-9. 99 (1H, m).

15 MS:m/e (ESI) 622. 3 (MH⁺)

実施例 813

へプタデカン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 83 (3H, t, J=7Hz), 1. 15-1. 28 (28H, m), 1. 34 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7Hz), 1. 61-1. 70 (1H, m), 2. 67 (2H, t, J=7Hz), 2. 83 (3H, d, J=5Hz), 4. 28 (2H, q, J=7Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 28 (1H, d, J=8Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 93 (1H, d, J=8Hz), 7. 98 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=5Hz), 8. 57 (1H, s).

25 実施例 814

へプタデカン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ

-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.83 (3H, t, J=7Hz), 1.15-1.27 (28H, m), 1.29 (3H, t, J=7Hz), 1.33 (9H, s), 1.38 (3H, t, J=7Hz), 1.39 (3H, t, J=7Hz), 1.60-1.70 (2H, m), 2.67 (2H, t, J=7Hz), 4.11 (2H, q, J=7Hz), 4.20 (2H, q, J=7Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.28 (1H, d, J=8Hz), 7.32 (1H, s), 7.92 (1H, d, J=8Hz), 7.97 (1H, s).

実施例 815

酢酸 2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.33 (3H, t, J=7Hz), 1.15-1.30 (28H, m), 1.62-1.70 (2H, m), 2.32 (3H, s), 2.58 (3H, s), 2.68 (3H, t, J=7Hz), 3.99 (2H, q, J=7Hz), 4.84 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.29 (1H, d, J=8Hz), 7.94 (1H, d, J=8Hz), 7.98 (1H, s).

実施例 816

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-5,6-ジエトキシ-2,3-ジヒドロ-イソインドール-1-オン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.45-1.52 (6H, m), 1.46 (9H, s), 4.10-4.19 (4H, m), 4.42 (2H, s), 5.00 (2H, s), 5.80 (1H, s), 6.91 (1H, s), 7.34 (1H, s), 7.90 (2H, s).

実施例 817

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.08-1.11 (4H, m), 2.02-2.08 (2H, m), 2.29-2.34 (1H, m), 3.08-3.13 (2H, m), 3.15-3.4

2 (2H, m), 3. 65 (3H, s), 4. 05 (2H, s), 4. 26 (1H, br), 4. 82 (2H, s), 5. 55 (2H, d, J=4. 8Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 10 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 45 (1H, brs), 9. 66 (1H, brs).

実施例 818

- 5 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イル オキシ)-酢酸 メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 08-1. 10 (4H, m), 2. 01-2. 10 (2H, m), 2. 30-2. 33 (1H, m), 3. 11-3. 14 (2H, m), 3. 40-3. 4 4 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 65 (3H, m), 4. 17 (2H, s), 4. 26 (1H, br), 4. 82 (2H, s), 5. 56 (2H, d, J=4. 4Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9 . 49 (1H, brs), 9. 66 (1H, brs).

実施例 819

- 15 {2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 24 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 32-1. 45 (12H, m), 1. 99-2. 12 (2H, m), 2 . 66 (2H, t, J=7. 0Hz), 3. 98-4. 30 (8H, m), 4. 77 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 598. 3 (MH⁺)

実施例 820

- 25 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 65-1. 75 (2H, m), 1. 78-1. 87 (2H, m), 2. 23-2. 37 (3H, m), 3. 87 (3H, s), 3.

95 (H, s), 4.13 (2H, t, J=7Hz), 4.81 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.17 (1H, d, J=8Hz), 7.35 (1H, s), 7.83 (1H, d, J=2Hz), 7.88 (1H, dd, J=2Hz, 8Hz), 9.07 (1H, brs), 9.35 (1H, brs).

実施例 821

5 5-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.05-1.14 (4H, m), 1.37 (9H, s), 1.65-1.75 (2H, m), 1.78-1.88 (2H, m), 2.25-2.37 (1H, m), 2.30 (2H, t, J=7Hz), 4.13 (2H, t, J=7Hz), 4.82 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.18 (1H, d, J=8 Hz), 7.72 (1H, d, J=8Hz), 7.84 (1H, s), 7.91 (1H, d, J=8Hz), 8.09 (1H, d, J=8Hz), 9.51 (1 H, brs), 9.65 (1H, brs).

実施例 822

15 5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.63-1.68 (2H, m), 1.78-1.82 (2H, m), 1.91-1.99 (1H, m), 2.03-2.12 (1H, m), 2.29 (2H, t, J=6.4Hz), 3.05-3.10 (2H, m), 3.23 (3H, s), 3.20-3.38 (2H, m), 3.73 (2H, q, J=4.4Hz), 3.86 (3H, s), 3.94 (3H, s), 4.04 (1H, brs), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.3 3 (1H, s), 7.36 (1H, s), 7.46 (1H, s), 9.07 (1H, brs), 9.30 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 600.3 (MH⁺)

実施例 823

25 5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸 メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 62-1. 71 (2H, m), 1. 76-1. 82 (2H, m), 1. 92-1. 98 (1H, m), 2. 04-2. 12 (1H, m), 2. 39 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 02-3. 12 (2H, m), 3. 23 (3H, s), 3. 26-3. 34 (2H, m), 3. 58 (3H, s), 3. 71-3. 76 (2H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 01-4. 07 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 37 (1H, s); 7. 46 (1H, s), 9. 08 (1H, s), 9. 33 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 614. 3 (MH⁺)

実施例 824

5-{2-第3 ブチル-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 09 (3H, t, J=6. 4Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 68-1. 70 (2H, m), 1. 76-1. 84 (2H, m), 1. 88-1. 98 (1H, m), 2. 04-2. 12 (1H, m), 2. 28 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 04-3. 12 (2H, m), 3. 26-3. 47 (3H, m), 3. 78 (2H, q, J=6. 4Hz), 3. 87 (3H, s), 3. 89-3. 90 (2H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 14 (1H, brs), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 30 (1H, brs).

15

MS:m/e (ESI) 628. 4 (MH⁺)

実施例 825

5-{2-第3 ブチル-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 メチルエステル;塩酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 09 (3H, t, J=6. 7Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 68-1. 71 (2H, m), 1. 74-1. 82 (2H, m), 1. 88-1. 98 (1H, m), 2. 04-2. 12 (1H, m), 2. 39 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 03-3. 11 (2H, m), 3. 24-3. 38 (2H, m), 3. 77-3. 80 (2H, m), 3. 58 (3H, s), 3. 86 (3H, s), 3. 88-3. 92 (2H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 11-4. 15 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 9. 09 (1H, s), 9. 37 (1H, s).

25

MS:m/e (ESI) 628. 3 (MH⁺)

実施例 826

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 68-1. 72 (2H, m), 1. 77-1. 85 (2H, m), 2. 18-2. 21 (1H, m), 2. 40 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 08-3. 12 (1H, m), 3. 24-3. 38 (3H, m), 3. 58 (3H, s), 3. 85 (3H, s), 3. 86-3. 92 (3H, m), 3. 94 (3H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 40 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 93 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 609. 3 (MH⁺)

実施例 827

3-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジルオキシ}-4-シアノ-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 31 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 65 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 75-3. 06 (6H, m), 4. 08 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 67 (2H, dd, J=11. 6Hz, 11. 6Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 72 (1H, s), 7. 77 (1H, s), 7. 92 (1H, s), 8. 20 (1H, d, J=4. 4Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 23 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

実施例 828

4-{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 91 (6H, t, J=6. 8Hz), 1. 21 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 32 (9H, s), 2. 02-2. 13 (2H, m), 2. 48 (2H

, t, J=7.6Hz), 3.04-3.19 (4H, m), 3.91 (3H, s), 3.93 (3H, s), 4.06-4.17 (4H, m), 4.72 (2H, s), 5.65 (2H, s), 6.83 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.59 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 586.3 (MH⁺)

実施例 829

- 5 4-{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 0.93 (6H, br), 1.17 (3H, br), 1.35 (12H, br), 2.01 (2H, br), 2.42-2.56 (2H, br), 2.76 (3H, br), 3.60-4.48 (6H, m), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.48 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.90 (1H, s), 8.53 (1H, br), 9.42 (1H, s), 9.94 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 610.4 (MH⁺)

実施例 830

- 15 2-{2-[3-第3ブチル-5-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.36 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.85 (3H, d, J=4.0Hz), 3.02 (3H, s), 3.32 (3H, s), 4.30 (2H, q, J=6.8Hz), 4.89 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.57 (1H, s), 7.79 (1H, s), 7.84 (1H, s), 7.93 (1H, s), 8.23 (1H, q, J=4.0Hz), 8.58 (1H, s), 9.25 (1H, s), 9.89 (1H, s).

実施例 831

- 25 2-{2-[3-第3ブチル-5-(ジメタンスルフォニル-アミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.37 (9H, s), 1.44 (3H, t, J=6.4Hz), 2.84 (3H, s), 3.61 (6H, s), 4.30 (2H, q, J=6.4Hz), 4

. 90 (2H, s), 5. 58 (2H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 87 (1H, s), 7. 93 (1H, s), 8. 09 (1H, s), 8. 22 (1H, s), 8. 59 (1H, s), 9. 28 (1H, s), 9. 88 (1H, s).

実施例 832

5 1-(7-第 3 ブチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 50 (9H, s), 4. 14 (2H, d, J=7. 2Hz), 4. 24 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 62 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 92 (1H, s), 8. 44 (1H, s), 8. 98 (1H, s), 9. 11 (1H, s), 9. 40 (1H, s).

10 実施例 833

1-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-2,5-ジオン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 27 (9H, s), 2. 74-2. 95 (4H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 35 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 37 (1H, s), 7. 94 (1H, dd, J=8. 0, 2. 0Hz), 8. 10 (1H, d, J=2. 0Hz).

実施例 834

20 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 10-1. 23 (4H, m), 1. 74-2. 10 (2H, m), 2. 27-2. 35 (1H, m), 2. 43 (1H, t, J=7. 2Hz), 3. 42 (1H, dd, J=7. 2, 6. 0Hz), 3. 90 (1H, ddd, J=7. 2, 5. 6, 1. 6Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 5. 45 (1H, dd, 6. 0, 1. 6Hz), 6. 81 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 66 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 83 (1H, dd, J=8. 4, 2. 0Hz), 7. 93 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 99 (1H, d, J=8. 4Hz).

実施例 835

4-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 75-1. 84 (2H, m), 2. 25-2. 31 (2H, m), 3. 30-3. 40 (2H, m), 3. 86 (3H, s), 3
5 . 95 (3H, s), 4. 78 (2H, s), 5. 35 (2H, s), 5. 70-5. 78 (1H, m), 6. 75 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 74 (1H, s), 9. 00-9. 07 (1H, m), 9. 28-9. 32 (1H, m).

実施例 836

5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ペンタン酸;塩酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 61-1. 70 (2H, m), 1. 76-1. 84 (2H, m), 2. 12-2. 22 (1H, m), 2. 28 (2H, t, J=6
8Hz), 2. 36-2. 41 (1H, m), 3. 02-3. 10 (1H, m), 3. 25-3. 29 (1H, m), 3. 42-3. 49 (1H, m), 3.
61-3. 70 (1H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 01-4. 08 (2H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 40 (1H, b
15 rd, J=56Hz), 5. 55 (2H, d, J=4. 4Hz), 7. 36 (1H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 9. 10 (1H, b
r), 9. 45 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 588. 3 (MH⁺)

実施例 837

5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ペンタン酸 メチルエステル;塩酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 61-1. 72 (2H, m), 1. 75-1. 84 (2H, m), 2. 08-2. 22 (2H, m), 2. 38 (2H, t, J=6
8Hz), 3. 02-3. 10 (1H, m), 3. 25-3. 28 (1H, m), 3. 42-3. 50 (1H, m), 3. 58 (3H, s), 3. 64-3.
68 (1H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 40-4. 42 (2H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 40 (1H, brd, J=
25 56Hz), 5. 59 (2H, d, J=4. 0Hz), 7. 36 (1H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 9. 12 (1H, brs), 9

. 51 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 602. 3 (MH⁺)

実施例 838

5 3-{3-第3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジルオキシ}-4-シアノ-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 59-3. 11 (8H, m), 4. 29 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 68 (2H, dd, J=12. 0Hz, 12. 0Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 7. 79 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4. 4Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 23 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

実施例 839

15 5-{2-第3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 18 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 66-1. 88 (4H, m), 2. 25-2. 42 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 05 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 14 (2H, t, J=7. 0Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 17 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 83 (1H, s), 7. 90 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 840

20 5-{2-第3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシメチル}-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-カルボン酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 38 (9H, s), 1. 85-1. 90 (4H, m), 3. 06-3. 14 (4H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 92-3. 99 (1H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 06-4. 10 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 16-5. 22 (1H, m), 5. 58 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 40 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 9. 11 (1H, s), 9. 51 (1H, s).

実施例 841

5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシメチル}-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-カルボン酸 メチルエステル;塩酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1.38 (9H, s), 1.84-1.91 (4H, m), 3.06-3.18 (4H, m), 3.78 (3H, s), 3.86 (3H, s), 3.96-4.00 (1H, m), 3.95 (3H, s), 4.09 (1H, dd, $J=7.2, 10.4\text{Hz}$), 4.79 (2H, s), 5.17-5.26 (1H, m), 5.55 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.48 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 9.10 (1H, s), 9.45 (1H, s).

10 実施例 842

6-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1.22-1.58 (12H, m), 2.83 (3H, brs), 4.20-4.46 (2H, m), 4.88 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.17-7.48 (2H, m), 7.55 (1H, s), 7.85-7.99 (1H, m), 8.03 (1H, s), 8.15-8.26 (1H, m), 8.29-8.41 (1H, m), 8.57 (1H, s), 8.66 (1H, brs), 9.18-9.27 (1H, m), 9.79-9.97 (2H, m).

実施例 843

6-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸メチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1.34 (9H, s), 1.42 (3H, t, $J=7.2$), 2.83 (3H, d, $J=4.4$), 3.85 (3H, s), 4.15-4.42 (2H, m), 4.88 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.15-7.35 (2H, m), 7.55 (1H, s), 7.95 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 8.04 (1H, s), 8.13-8.28 (1H, m), 8.39 (1H, dd, $J=8.4$ and 2.4Hz), 8.57 (1H, s), 8.69 (1H, brs), 9.17-9.29 (1H, m), 9.80-9.92 (2H, m).

実施例 844

5-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1.14-1.18 (4H, m), 1.21-1.25 (2H, m), 1.38 (9H, s), 1.94-2.03 (2H, m), 2.09-2.21 (3H, m), 2.43 (2H, br. t, $J=6\text{Hz}$), 2.71-2.80 (1H, brs), 2.96-3.07 (2H, brs), 3.28-3.37 (2H, brs), 3.69 (3H, s), 3.70 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 4.21-4.26 (2H, brs), 4.88 (2H, s), 6.40 (2H, s), 7.65 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.77-7.82 (3H, m).

10 実施例 845

5-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1.20 (2H, m), 1.38 (9H, s), 1.84-1.92 (2H, m), 2.06-2.16 (2H, m), 2.44 (2H, br. t, $J=6\text{Hz}$), 2.70-2.79 (2H, 1H, brs), 2.95-3.06 (2H, brs), 3.26-3.37 (2H, brs), 3.69 (3H, s), 3.69 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 3.96 (3H, s), 3.98 (3H, s), 4.20-4.24 (2H, m), 4.85 (2H, s), 6.09 (2H, s), 6.92 (1H, s), 7.76 (2H, s).

実施例 846

20 [2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 0.97 (3H, d, $J=5.2\text{Hz}$), 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.48-2.22 (4H, m), 2.70-2.91 (1H, m), 2.82 (3H, d, $J=3.2\text{Hz}$), 3.68-3.80 (1H, m), 3.85 (1H, d, $J=15.2\text{Hz}$), 4.27 (2H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 4.83 (2H, s), 5.03 (1H, d, $J=15.2\text{Hz}$), 5.44 (1H, d, $J=18.8\text{Hz}$), 5.52 (1H, d,

J=18.8Hz), 7.43 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.12-8.30 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.14 (1H, brs), 9.83 (1H, brs).

実施例 847

5 [2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸 エチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.97 (3H, d, J=5.6Hz), 1.22 (3H, t, J=7.2Hz), 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.46-1.58 (1H, m), 1.65-1.80 (1H, m), 1.81-1.94 (1H, m), 2.08-2.22 (1H, m), 2.68-2.80 (1H, m), 2.82 (3H, d, J=4.0Hz), 3.40-3.58 (1H, m), 3.65-3.79 (1H, m), 4.00 (1H, d, J=15.6Hz), 4.10-4.35 (4H, m), 4.84 (2H, s), 5.07 (1H, d, J=15.6Hz), 5.45 (1H, d, J=19.2Hz), 5.53 (1H, d, J=19.2Hz), 7.45 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.20 (1H, brs), 8.55 (1H, s), 9.15 (1H, brs), 9.84 (1H, brs).

実施例 848

15 2-{2-[3-(アセチル-メチル-アミノ)-5-第3ブチル-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.34 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.81 (3H, brs), 2.83 (3H, d, J=4.8Hz), 3.29 (3H, s), 4.29 (2H, q, J=7.2Hz), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.55 (1H, s), 7.65-7.98 (3H, m), 8.12-8.27 (1H, m), 8.57 (1H, s), 9.22 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

実施例 849

25 6-[2-(8-第3ブチル-4-メタンスルフォニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28-1. 46 (12H, m), 1. 81 (3H, brs), 2. 77 (3H, d, J=3. 6Hz), 3. 18 (3H, s), 3. 86 (2H, brs), 4. 24 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 45 (2H, brs), 4. 88 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 66 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 14 (1H, s), 8. 43-8. 61 (1H, m), 9. 34-9. 48 (1H, m), 9. 87-10. 01 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 544. 2 (MH⁺)

5 実施例 850

5-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 18 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 68-1. 82 (4H, m), 2. 39 (2H, t, J=6. 8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 0Hz), 2. 94-3. 02 (4H, m), 3. 76-3. 83 (4H, m), 4. 04 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 24 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 63 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 0Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 19 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

15 実施例 851

5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 17 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 70-1. 84 (4H, m), 2. 37-2. 44 (2H, m), 2. 96-3. 03 (4H, m), 3. 75-3. 92 (4H, m), 3. 97 (3H, s), 3. 96 (3H, s), 4. 04 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 24 (2H, t, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 62 (1H, s).

実施例 852

25 (1-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 99-2. 12 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=3. 6Hz), 3. 06-3. 16 (2H, m), 3. 64 (3H, s), 4. 05 (2H, s), 4. 16-4. 35 (3H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 48 (2H, brs), 7 . 35 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 13-8. 24 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 10-9. 18 (1H, m), 9. 79-9. 89 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 581. 3 (MH⁺)

実施例 853

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 24-1. 54 (12H, m), 1. 98-2. 14 (2H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 06-3. 15 (2H, m), 3. 64 (3H, s), 4. 05 (2H, s), 4. 13-4. 42 (2H, m), 4. 87 (2H, s), 5. 53 (2H, brs), 7. 34 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 42-8. 62 (1H, m), 9. 32-9. 45 (1H, m), 9. 90-10. 00 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 582. 3 (MH⁺)

実施例 854

(1-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 98-2. 13 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 06-3. 15 (2H, m), 3. 38-3. 48 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 64 (3H, s), 4. 17 (2H, s), 4. 18-4. 40 (3H, m), 4. 84 (2H, s), 5. 40-5. 56 (2H, m), 7. 34 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 44 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, s), 8. 11-8. 28 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 12-9. 18 (1H, m), 9. 79-9. 86 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 595. 3 (MH⁺)

実施例 855

メチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバ
モイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.35 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.70 (3H, d, J=4.4Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.28
(2H, q, J=6.8Hz), 4.86 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.26 (1H, d, J=8.4Hz), 7.54 (1H, s), 7.86-
7.93 (3H, m), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.20 (1H, brs), 9.85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481.1 (MH⁺)

実施例 856

- 10 メチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水
素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.35 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 2.70 (3H, d, J=4.8Hz), 4.11
(2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.80 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.25 (1H, d, J=8.8
Hz), 7.33 (1H, s), 7.88-7.92 (3H, m).

MS:m/e (ESI) 486.2 (MH⁺)

実施例 857

- 20 メチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバ
モイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エ
ステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.35 (9H, s), 1.36 (3H, t, J=7.0Hz), 2.70 (3H, d, J=4.6Hz), 2.78 (3H, d, J=4.6Hz), 4.24
(2H, q, J=7.0Hz), 4.90 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.26 (1H, d, J=8.4Hz), 7.87-7.94 (3H, m),
8.00 (1H, s), 8.53 (1H, q, J=4.6Hz), 9.43 (1H, brs), 9.96 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 482.1 (MH⁺)

実施例 858

{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;塩酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 28 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.32 (9H, s), 1.40 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 2.56 (1H, dd, $J=16.8, 8.2\text{Hz}$), 2.77 (1H, dd, $J=16.8, 4.0\text{Hz}$), 2.92 (3H, s), 3.08 (1H, dd, $J=16.4, 8.0\text{Hz}$), 3.62-3.72 (1H, m), 4.12 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 7.22 (2H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 4.58-4.64 (1H, m), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.18 (1H, s), 7.24 (1H, s).

10 実施例 859

{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;塩酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1.34 (9H, s), 2.54 (1H, dd, $J=16.8, 8.2\text{Hz}$), 2.74 (1H, dd, $J=16.8, 4.4\text{Hz}$), 2.94 (3H, s), 3.08 (1H, dd, $J=16.4, 8.0\text{Hz}$), 3.60-3.72 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.97 (3H, s), 4.57-4.64 (1H, m), 4.80 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.18 (1H, s), 7.27 (1H, s), 7.36 (1H, s).

実施例 860

{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;塩酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

20 1.29 (9H, s), 1.36 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 2.50-2.62 (1H, m), 2.75-2.82 (1H, m), 2.78 (3H, d, $J=4.0\text{Hz}$), 2.92 (3H, s), 3.04-3.12 (1H, m), 3.62-3.74 (1H, m), 4.24 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4.58-4.64 (1H, m), 4.88 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.19 (1H, s), 7.30 (1H, s), 7.98 (1H, s), 8.56 (1H, q, $J=4.0\text{Hz}$), 9.94 (1H, brs).

実施例 861

{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 20 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 29 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 30 (9H, s), 1. 39 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 2. 62 (1H, dd, $J=16.0, 8.8\text{Hz}$), 2. 88 (1H, dd, $J=16, 3.6\text{Hz}$), 2. 90 (3H, s), 3. 08 (1H, dd, $J=12, 8.0\text{Hz}$), 3. 38 (1H, dd, $J=12, 3.6\text{Hz}$), 4. 08 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 10 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 21 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 60-4. 66 (1H, m), 4. 78 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 19 (1H, s), 7. 28 (1H, s), 7. 34 (1H, s), 9. 03 (1H, brs), 9. 36 (1H, brs).

10

実施例 862

{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

15 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 20 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 30 (9H, t), 2. 62 (1H, dd, $J=16, 9.2\text{Hz}$), 2. 86 (1H, dd, $J=16, 3.2\text{Hz}$), 2. 90 (3H, s), 3. 08 (1H, dd, $J=12, 8.0\text{Hz}$), 3. 40 (1H, dd, $J=12, 2.4\text{Hz}$), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 11 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 60-4. 68 (1H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 18 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7. 28 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7. 35 (1H, s), 9. 04 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

20 実施例 863

{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1. 20 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 29 (9H, s), 1. 37 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 2. 62 (1H, dd, $J=19.2, 8.8\text{Hz}$), 2. 77 (3H, d, $J=4.0\text{Hz}$), 2. 86 (1H, dd, $J=19.2, 3.2\text{Hz}$), 2. 91 (3H, s), 3. 09 (1H, dd, $J=12$

, 8. 8Hz), 3. 40 (1H, dd, J=12, 3. 6Hz), 4. 09 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 23 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 5
7-4. 70 (1H, m), 4. 87 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 29 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 55
(1H, q, J=4. 0Hz), 9. 51 (1H, brs), 9. 96 (1H, brs).

実施例 864

- 5 2-(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イル
オキシ)-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 0. 92 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 44 (9H, s), 1. 61-1. 83 (2H, m), 2. 10-2. 24 (2H, m), 3. 09-3. 17 (
1H, m), 3. 19-3. 26 (1H, m), 3. 41-3. 56 (2H, m), 3. 74 (3H, s), 3. 92 (1H, dd, J=7. 6and4. 8H
z), 3. 94 (3H, s), 4. 02 (3H, s), 4. 25-4. 33 (1H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 24 (1H, s
) , 7. 46 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 60 (1H, d, J=2. 0Hz).

実施例 865

- 15 2-(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イル
オキシ)-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 00 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 44 (9H, s), 1. 63-1. 87 (2H, m), 2. 04-2. 19 (2H, m), 3. 13-3. 22 (
1H, m), 3. 22-3. 30 (1H, m), 3. 40-3. 57 (2H, m), 3. 74 (3H, s), 3. 94 (3H, s), 3. 98 (1H, dd, J
=7. 6and4. 4Hz), 4. 02 (3H, s), 4. 25-4. 35 (1H, m), 4. 86 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 24 (1H, s
) , 7. 46 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 60 (1H, d, J=2. 0Hz).

実施例 866

- 25 8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ
ジン-2-カルボン酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 17 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 28 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39 (9H, s), 1. 27-1. 44 (3H, m), 2. 91 (3H, s), 3. 42-3. 55 (2H, m), 4. 12 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 10-4. 20 (2H, m), 4. 22 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 28-5. 32 (1H, m), 5. 47 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 32-7. 36 (2H, m), 9. 03 (1H, brs), 9. 34 (1H, brs).

5 実施例 867

2-(3, 5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-ベンゾイルアミノ)-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩
 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 41 (21H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 99 (2H, s), 7. 47 (1H, s),
 10 7. 77 (2H, s), 8. 20 (1H, q, 4. 8Hz), 8. 52 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 481. 2 (MH⁺)

実施例 868

1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水
 15 素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 75 (6H, s), 3. 82 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 45 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 06 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

20 実施例 869

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 75 (6H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 0Hz), 2. 92 (6H, s), 3. 82 (3H, s), 4. 73 (2H, s),
 25 5. 44 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 45 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 06 (1H,), 8. 36 (1H, q, J=4. 0H

z), 8.93 (1H, brs), 9.49 (1H, brs).

実施例 870

6-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 2.76 (6H, s), 2.77 (3H, d, J=4.0Hz), 3.83 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.85 (2H, s), 5.60 (2H, s), 7.48 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.00 (1H, s), 8.57 (1H, q, J=4.0Hz), 9.56 (1H, brs), 9.97 (1H, brs).

10 実施例 871

{8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.35 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.81 (1H, dd, J=16.8, 8.0Hz), 3.05 (1H, dd, J=16.8, 4.0Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 4.98 (1H, d, J=4.0Hz), 5.45 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.41 (1H, d, J=2.0Hz), 7.53 (1H, d, J=2.0Hz), 9.03 (1H, brs), 10.97 (1H, brs).

実施例 872

20 {8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.17 (3H, t, J=7.2Hz), 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.33 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 2.92 (1H, dd, J=16Hz, 8.0Hz), 3.14 (1H, dd, J=16Hz, 4.0Hz), 4.04-4.17 (4H, m), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.04 (1H, dd, J=8.0Hz, 4.0Hz), 5.44 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.41

(1H, s), 7.52 (1H, s), 9.05 (1H, brs), 9.32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 570.2 (MH⁺)

実施例 873

5 2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イル
オキシ)-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.83 and 0.87 [3H (1:1). each t. each
 J=7.2Hz], 1.10-1.28 (3H, m), 1.38 (9H, s), 1.49-1.75 (2H, m), 1.92-2.17 (2H, m), 2.99
 10 -3.20 (2H, m), 3.25-3.52 (2H, m), 3.64 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.02-4.29 (3
 H, m), 4.81 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.37 (1H, s), 7.44 (1H, s), 9.02-9.13 (1H
 , m), 9.26-9.39 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 614.3 (MH⁺)

実施例 874

15 1-(3-第3ブチル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.33 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21
 (2H, q, J=6.8Hz), 4.82 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.55 (1H, t, J=8.0Hz), 7.78 (
 20 1H, d, J=8.0Hz), 7.83 (1H, d, J=8.0Hz), 7.97 (1H, s), 9.05 (1H, brs), 9.35 (1H, brs).

実施例 875

2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジ
メチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチル
アミド;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.77 (3H, d, J=4.4Hz), 2.92 (6H, s), 3.89 (3H, s), 4

. 13 (2H, q, J=6.8Hz), 4.74 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.51 (2H, d, J=7.6Hz), 8.07 (1H, s), 8.35-8.38 (1H, m), 8.94 (1H, brs), 9.54 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481.2 (MH⁺)

実施例 876

- 5 2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.36 (9H, s), 1.39-1.43 (6H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.89 (3H, s), 4.13 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.85 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.51-7.54 (3H, m), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.20 (1H, brs), 9.85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 482.2 (MH⁺)

実施例 877

- 15 1-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.38-1.43 (6H, m), 3.89 (3H, s), 4.08-4.24 (6H, m), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.51 (2H, d, J=5.2Hz), 9.03 (1H, brs), 9.26 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 487.2 (MH⁺)

実施例 878

- 25 6-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.40-1.43 (6H, m), 2.78 (3H, d, J=4.8Hz), 3.90 (3H, s), 4.13 (2H, q, J=7.0

Hz), 4.24 (2H, q, J=7.0Hz), 4.89 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.50-7.52 (2H, m), 8.00 (1H, s), 8.53 (1H, m), 9.42 (1H, brs), 9.96 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 483.1 (MH⁺)

実施例 879

- 5 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.62-1.77 (2H, m), 1.96-2.10 (2H, m), 2.68-2.90 (5H, m), 3.12-3.59 (3H, m), 3.94 (3H, s), 4.08 (2H, s), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.83 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.58 (1H, s), 8.14-8.27 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.09-9.17 (1H, m), 9.78-9.88 (1H, m).

実施例 880

- 15 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.36 (9H, s), 1.63-1.76 (2H, m), 1.97-2.08 (2H, m), 2.69-2.82 (2H, m), 3.16-3.60 (3H, m), 3.87 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.07 (2H, s), 4.80 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.57 (1H, s), 9.06-9.10 (1H, m), 9.24-9.32 (1H, m).

実施例 881

- 25 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.19 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.64-1.78 (2H, m), 1.97-2.

10 (2H, m), 2.69-2.80 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.18-3.30 (2H, m), 3.49-3.60 (1H, m), 3.93 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.2Hz), 4.16 (2H, s), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.58 (1H, s), 8.14-8.30 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.09-9.22 (1H, m), 9.77-9.91 (1H, m).

5 MS:m/e (ESI) 623.2 (MH⁺)

実施例 882

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.19 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.62-1.78 (2H, m), 1.97-2.10 (2H, m), 2.69-2.84 (2H, m), 3.17-3.32 (2H, m), 3.50-3.58 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.2Hz), 4.17 (2H, s), 4.80 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.57 (1H, s), 9.06-9.12 (1H, m), 9.24-9.35 (1H, m).

15 MS:m/e (ESI) 600.2 (MH⁺)

実施例 883

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.38-1.41 (12H, m), 3.68 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.70 (1H, d, J=7.6Hz), 7.95-8.10 (2H, m), 9.02 (1H, brs), 9.31 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 507.1 (MH⁺)

25 実施例 884

{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1. 37 (9H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 89 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 34 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 7. 70 (1H, s), 9. 10 (1H, brs), 9. 37 (1H, brs).

実施例 885

4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチロニトリル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 07-2. 16 (2H, m), 2. 67-2. 75 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 90 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 11-4. 18 (2H, m), 4. 82 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 49-7. 59 (2H, m), 9. 00-9. 17 (1H, brs), 9. 27-9. 40 (1H, m).

実施例 886

15 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-シアノメトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 37 (9H, s), 2. 73-2. 82 (3H, m), 2. 91 (6H, s), 3. 89 (3H, s), 4. 78 (2H, s), 5. 33 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 31-8. 46 (1H, m), 8. 97 (1H, brs), 9. 55 (1H, brs).

実施例 887

25 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 2. 06-2. 17 (2H, m), 2. 71 (2H, t, J=7. 6Hz), 2. 77 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 89 (3H, s), 4. 24 (2H, t, J=6. 0Hz), 4. 74 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 33-8. 41 (1H, m), 8. 95 (1H, brs), 9. 55 (1H, brs).

実施例 888

- 5 2-[2-(8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 36-1. 43 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 28 (2H, q, J=7Hz), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 42-7. 45 (2H, m), 7. 53 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 82 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 504. 3 (MH⁺)

実施例 889

- 15 6-[2-(8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 33-1. 38 (12H, s), 2. 78 (3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 25 (2H, q, J=7Hz), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 40-7. 43 (2H, m), 7. 99 (1H, s), 8. 53 (1H, q, J=5Hz), 9. 46 (1H, brs), 9. 93 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 505. 3 (MH⁺)

実施例 890

- 25 {8-第 3 ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イル}-アセトニトリル; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 3. 30-3. 40 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 40-7. 42 (2H, m), 9. 06 (1H, brs), 9. 35 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481. 3 (MH⁺)

5 実施例 891

{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-アセトニトリル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 33-1. 42 (12H, m), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 11 (2H, q, J=7Hz), 4. 21 (2H, q, J=7Hz), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 40-7. 42 (2H, m), 9. 03 (1H, brs), 9. 34 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 509. 3 (MH⁺)

実施例 892

15 {8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-アセトニトリル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 06-1. 11 (4H, m), 1. 36 (9H, s), 2. 32 (1H, m), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 41-7. 44 (2H, m), 7. 72 (1H, d, J=8Hz), 8. 09 (1H, d, J=8Hz), 9. 52, (1H, brs), 9. 64 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 444. 3 (MH⁺)

実施例 893

25 2-[2-(8-第3ブチル-4-シアノメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 41-7. 43 (2H, m), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4Hz), 8. 98 (1H, brs), 9. 53 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 503. 4 (MH⁺)

実施例 894

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-シアノメトキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 34 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 8. 15-8. 30 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 14-9. 26 (1H, m), 9. 77-9. 93 (1H, m).

実施例 895

15 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-メトキシフェニル]-2-オキシエチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 06-2. 17 (2H, m), 2. 72 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 90 (3H, s), 4. 15 (2H, t, J=6. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 49-7. 62 (3H, m), 8. 15-8. 26 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 18 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

実施例 896

25 2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシベンゾイルアミノ)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (9H, s), 1. 41 (3H, t, 6. 8Hz), 2. 74 (6H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 80 (3H, s), 4. 26 (2H, q, J=6. 8Hz), 5. 00 (2H, s), 7. 5-7. 6 (3H, m), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz) 8. 60 (1H, s), 9. 75 (1H, s), 10. 30 (1H, s), 11. 53 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 482. 1 (MH⁺)

実施例 897

{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 37 (9H, s), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 31-7. 35 (2H, m), 7. 88 (1H, s), 7. 97-7. 99 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 440. 1 (MH⁺)

実施例 898

{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 08-1. 11 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 2. 30-2. 34 (1H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 33 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 72 (1H, d, J=8. 2Hz), 7. 89 (1H, s), 8. 00 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 2Hz), 9. 60 (2H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 403. 0 (MH⁺)

実施例 899

2-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ
シ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化
水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86

(2H, s), 5.41 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, d, J=8.6Hz), 7.54 (1H, s), 7.89 (1H, s), 8.00 (1H, d, J=8.6Hz), 8.21 (1H, m), 8.56 (1H, s), 9.19 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 463.1 (MH⁺)

実施例 900

- 5 1-(3-第 3 ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0Hz), 3.87 (3H, s), 3.89 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.13 (2H, q, J=7.0Hz), 4.81 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.51 (1H, s), 9.03 (1H, brs), 9.30 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 459.1 (MH⁺)

実施例 901

- 15 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-5-エトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.38 (9H, s), 1.45 (3H, t, J=7.2Hz), 2.78 (3H, d, J=4.6Hz), 2.92 (6H, s), 4.19 (2H, q, J=7.2Hz), 4.74 (2H, s), 5.19 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.55 (2H, s), 8.07 (1H, s), 8.36 (1H, q, J=4.6Hz), 8.95 (1H, brs), 9.53 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 506.2 (MH⁺)

実施例 902

- 25 {2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 45 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 19 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 19 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 54 (2H, d, J=1. 2Hz), 9. 08 (1H, br s), 9. 33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 484. 1 (MH⁺)

5 実施例 903

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 37 (9H, s), 2. 78 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92 (6H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 33 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 89 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 95 (1H, brs), 9. 53 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 462. 1 (MH⁺)

実施例 904

15 {2-第 3 ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 4. 12 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 88 (1H, s), 7. 98 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 02 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 468. 1 (MH⁺)

実施例 905

{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 67 (3H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 33 (1H, d, J=8. 4Hz)

), 7.71 (1H, d, J=8.4Hz), 7.89 (1H, d, J=2.0Hz), 8.00 (1H, dd, J=2.0, 8.4Hz), 8.16 (1H, d, J=8.4Hz), 9.50 (1H, brs), 9.97 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 377.0 (MH⁺)

実施例 906

5 {2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.31 (3H, t, J=7.6Hz), 1.37 (9H, s), 2.95 (2H, q, J=7.6Hz), 4.87 (2H, s), 5.41 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.33 (1H, d, J=8.8Hz), 7.74 (1H, d, J=8.0Hz), 7.90 (1H, s), 8.01 (1H, d, J=8.4Hz), 8.18 (1H, d, J=8.0Hz), 9.52 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 391.0 (MH⁺)

実施例 907

15 2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.82 (3H, d, J=4.0Hz), 2.94-3.04 (4H, m), 3.70-3.86 (4H, m), 3.95 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.50 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.61 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.56 (1H, s), 9.16 (1H, brs), 9.84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 524.2 (MH⁺)

実施例 908

25 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 95-3. 05 (4H, m), 3. 74-3. 85 (4H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 3. 96 (3H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 60 (1H, s).

実施例 909

5 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 08-1. 15 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 2. 28-2. 36 (1H, m), 2. 94-3. 06 (4H, m), 3. 75-3. 86 (4H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 10 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 910

15 {3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-アセトニトリル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 33 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 9. 00-9. 10 (1H, m), 9. 29-9. 37 (1H, m).

実施例 911

20 4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチロニトリル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 07-2. 17 (2H, m), 2. 72 (2H, t, J=7. 2Hz), 3. 90 (3H, s), 4. 07-4. 17 (4H, m), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 96-9. 09 (1H, m), 9. 23-9. 36 (1H, m)

実施例 912

{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水

5 素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1.05-1.16(4H, m), 1.37(9H, s), 2.27-2.37(1H, m), 3.89(3H, s), 4.84(2H, s), 5.33(2H, s), 5.56(2H, s), 7.65(1H, s), 7.70(1H, s), 7.72(1H, d, J=8.0Hz), 8.10(1H, d, J=8.0Hz), 9.51(1H, brs), 9.67(1H, brs).

10 実施例 913

4-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチロニトリル;
臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

15 1.05-1.18(4H, m), 1.36(9H, s), 2.07-2.18(2H, m), 2.28-2.38(1H, m), 2.72(2H, t, J=7.2Hz), 3.89(3H, s), 4.15(2H, t, J=6.0Hz), 4.83(2H, s), 5.56(2H, s), 7.55(2H, brs), 7.72(1H, d, J=8.0Hz), 8.10(1H, d, J=8.0Hz), 9.04-9.55(2H, m).

実施例 914

20 1-(3-第3ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素
酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

25 1.03-1.17(4H, m), 1.33(6H, d, J=6.0Hz), 1.35(9H, s), 2.25-2.37(1H, m), 3.88(3H, s), 4.65-4.79(1H, m), 4.82(2H, s), 5.56(2H, s), 7.51(2H, s), 7.72(1H, d, J=8.0Hz), 8.10(1H, d, J=8.0Hz), 9.46-9.73(2H, m).

実施例 915

1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 74 (6H, s), 3. 82 (3H, s), 4. 14 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 77 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 45 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 486. 2 (MH⁺)

実施例 916

- 10 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 95-3. 12 (4H, m), 3. 75-3. 84 (4H, m), 3. 94 (3H, s), 4. 12 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 20 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 59 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 528. 2 (MH⁺)

実施例 917

- 20 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 40-1. 43 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 68 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 97-8. 00 (2H, m), 8. 19-8. 22 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 20 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 502. 1 (MH⁺)

実施例 918

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4.8Hz), 2. 92 (6H, s), 3. 68 (3H, s), 4. 76 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 95-8. 00 (2H, m), 8. 07 (1H, s), 8. 34-8. 37 (1H, m), 8. 96 (1H, brs), 9. 57 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 501. 1 (MH⁺)

10 実施例 919

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 41 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4.4Hz), 3. 68 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 70 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 95-8. 00 (3H, m), 8. 52 (1H, m), 9. 44 (1H, brs), 9. 99 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 503. 1 (MH⁺)

実施例 920

20 2-{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロパン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 15 (3H, t, J=7Hz), 1. 33-1. 48 (12H, m), 3. 30-3. 40 (2H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 10. (2H, m), 4. 40 (2H, m), 4. 71 (1H, q, J=6Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 40 (1H, d, J=18Hz), 5. 50 (1H, d, J=18Hz), 7. 18 (1H, brs), 7. 27 (1H, brs), 7. 35 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 38 (1H

, brs).

実施例 921

2-[8-第 3 ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-
 5 イル}-プロパン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 03-1. 12 (4H, m), 1. 15 (3H, t, J=7Hz), 1. 35 (9H, s), 1. 44 (3H, d, J=6Hz), 2. 32 (1H, m),
 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 09 (2H, m), 4. 25-4. 30 (2H, m), 4. 28 (2H, m), 4. 71 (1H, q, J=6Hz), 4
 . 80 (2H, s), 5. 43 (1H, d, J=18Hz), 5. 52 (1H, d, J=18Hz), 7. 20 (1H, s), 7. 28 (1H, s), 7. 71
 10 (1H, d, J=8Hz), 8. 08 (1H, d, J=8Hz), 9. 50 (1H, brs), 9. 62 (1H, brs).

実施例 922

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-オキシ-
エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル
ボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (9H, s), 2. 71 (6H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 91 (6H, s), 4. 74 (2H, s), 5. 25 (2H, s
), 5. 46 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 60 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 35 (1H, m), 8. 92
 (1H, brs), 9. 53 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 505. 2 (MH⁺)

実施例 923

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-オキシ-
エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 91 (4H, brs), 2. 82 (3H, d, J=4. 0Hz), 3. 15 (4H, br
 s), 3. 64 (3H, s), 4. 27 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 43 (1

H, s), 7.53 (1H, s), 8.18-8.21 (1H, m), 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 507.2 (MH⁺)

実施例 924

5 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.91 (4H, brs), 3.15 (4H, brs), 3.64 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.78 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.34 (1H, s), 7.42 (1H, s), 9.01 (1H, brs), 9.23 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 512.2 (MH⁺)

実施例 925

15 2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-オキソエチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.91 (4H, brs), 2.78 (3H, d, J=4.4Hz), 2.91 (6H, s), 3.15 (4H, brs), 3.64 (3H, s), 4.72 (2H, s), 5.42 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.35 (1H, s), 7.43 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.35-8.38 (1H, m).

20 MS:m/e (ESI) 506.3 (MH⁺)

実施例 926

25 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.08-1.11 (4H, m), 1.38 (9H, s), 1.91 (4H, brs), 2.29-2.35 (1H, m), 3.15 (4H, brs), 3.6

5 (3H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 6Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 6Hz), 9. 50 (1H, brs), 9. 62 (1H, brs).

実施例 927

5 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 91 (4H, brs), 3. 15 (4H, brs), 3. 65 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 43 (1H, s), 9. 02 (1H, brs), 9. 23 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 484. 2 (MH⁺)

実施例 928

15 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (6H, d, J=6. 4Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 88 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 64-4. 77 (1H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 51 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 14-8. 26 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 12-9. 21 (1H, m), 9. 79-9. 89 (1H, m).

実施例 929

25 1-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 33 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 35 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 88

(3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.64-4.77 (1H, m), 4.80 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.50 (2H, s), 9.05 (1H, brs), 9.29 (1H, brs).

実施例 930

5 1-(3-第3ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.33 (6H, d, J=5.6Hz), 1.35 (9H, s), 3.87 (3H, s), 3.88 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.64-4.76 (1H, m), 4.81 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.50 (2H, s), 8.99-9.16 (1H, m), 9.25-9.40 (1H, m).

実施例 931

15 2-{8-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロパン酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.15 (3H, t, J=7Hz), 1.30-1.50 (15H, m), 2.82 (3H, d, J=5Hz), 3.30-3.40 (2H, m), 4.09 (2H, m), 4.22-4.36 (4H, m), 4.71 (1H, q, J=6Hz), 4.82 (2H, s), 5.38 (1H, d, J=18Hz), 5.48 (1H, d, J=18Hz), 7.20 (1H, brs), 7.28 (1H, brs), 7.53 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=5Hz), 8.55 (1H, s), 9.21 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

20 実施例 932

2-{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロパン酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.15 (3H, t, J=7Hz), 1.32-1.39 (12H, m), 1.44 (3H, d, J=7Hz), 2.33 (1H, m), 2.77 (3H, d, J=5Hz), 3.30-3.40 (2H, m), 4.09 (2H, m), 4.20-4.30 (4H, m), 4.71 (1H, q, J=7Hz), 4.86 (

2H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 43 (1H, d, J=18Hz), 5. 52 (1H, d, J=18Hz), 7. 20 (1H, d, J=2Hz), 7. 27 (1H, d, J=2Hz), 7. 98 (1H, s), 8. 55 (1H, q, J=5Hz), 9. 47 (1H, brs), 9. 92 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 566. 2 (MH⁺)

実施例 933

- 5 2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イル}-プロパン酸 エチルエステル; 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 15 (3H, t, J=7Hz), 1. 32-1. 39 (9H, m), 1. 44 (3H, d, J=7Hz), 2. 77 (3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 10 (2H, m), 4. 27 (2H, m), 4. 70-4. 73 (3H, m), 5. 35 (1H, d, J=18Hz), 5. 46 (1H, d, J=18Hz), 7. 14 (1H, s), 7. 21 (1H, d, J=2Hz), 7. 27 (1H, d, J=2Hz), 8. 08 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=5Hz), 9. 06 (1H, brs), 9. 57 (1H, brs).

実施例 934

- 15 2-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20 (6H, d, J=7. 2Hz), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 78 (6H, s), 2. 81 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 77 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 17 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

実施例 935

- 25 2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20 (6H, d, J=6. 8Hz), 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 78 (6H, s), 3. 76

(3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.22 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.34-7.36 (2H, m), 7.52 (1H, s).

実施例 936

5 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0Hz), 2.76 (3H, d, J=5.0Hz), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 3.72 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.84 (2H, s), 5.47 (2H, s), 5.51 (1H, q, J=5.0Hz), 7.05 (1H, s), 7.24 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4.4Hz), 8.55 (1H, s), 9.17 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 467.3 (MH⁺)

実施例 937

15 6-[2-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.26-1.43 (18H, m), 2.77 (3H, d, J=4.8Hz), 3.88 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.64-4.77 (1H, m), 4.88 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.50 (2H, s), 7.99 (1H, s), 8.47-8.58 (1H, m), 9.34-9.46 (1H, m), 9.90-10.03 (1H, m).

実施例 938

25 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.33 (6H, d, J=6.0Hz), 1.35 (9H, s), 2.77 (3H, d, J=4.4Hz), 2.91 (6H, s), 3.88 (3H, s), 4

. 63-4. 80 (3H, m), 5. 44 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 50 (2H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 31-8. 43 (1H, m), 8. 88-8. 99 (1H, m), 9. 46-9. 60 (1H, m).

実施例 939

5 2-[2-[3-第 3 ブチル-5-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 88-2. 13 (4H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 86-2. 98 (2H, m), 3. 02-3. 18 (3H, m), 3. 93 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2
10 H, s), 7. 52 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 61 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 14-8. 26 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 10-9. 18 (1H, m), 9. 81-9. 88 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 546. 2 (MH⁺)

実施例 940

15 1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イ
ミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 6. 95 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 32 (1H, s), 7. 75 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 80 (1H, s), 9. 00 (1H, brs), 9. 30 (1H, brs).

20 MS: m/e (ESI) 429. 1 (MH⁺)

実施例 941

25 2-[8-第 3 ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン
-4-イル]-2-メチル-プロパン酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 38 (3H, t, J=7Hz), 1. 48 (6H, s), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40 (2H, m),

4, 22-4. 40 (4H, m), 4. 82 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 08 (1H, brs), 7. 30 (1H, brs), 7. 52 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 551. 2 (MH⁺)

実施例 942

- 5 2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロパン酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 30-1. 40 (12H, m), 1. 48 (6H, s), 2. 77 (3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 22-4. 33 (4H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 08 (1H, brs), 7. 29 (1H, brs), 7. 98 (1H, s), 8. 54 (1H, q, J=5Hz), 9. 45 (1H, brs), 9. 91 (1H, brs).

実施例 943

- 15 酢酸 2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 33 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 33 (3H, s), 2. 65 (6H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 66 (1H, s), 8. 19-8. 21 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 17 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 509. 2 (MH⁺)

実施例 944

- 25 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s) 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz) 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz) 3. 82 (3H, s), 3. 93 (2H, t, J=7. 6

Hz), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.54 (2H, t, J=7.6Hz), 4.85 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.83 (1H, d, J=2.0Hz), 7.99 (1H, d, J=2.0Hz), 8.20 (1H, q, J=4.4Hz), 8.56 (1H, s).

実施例 945

- 5 酢酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 2.37 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.31-7.34 (2H, m), 7.93 (1H, d, J=8.4Hz), 7.96 (1H, s), 9.02 (1H, brs), 9.30 (1H, brs).

- 10 MS:m/e (ESI) 471.1 (MH⁺)

実施例 946

- 酢酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.35 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.37 (3H, s), 2.83 (3H, d, J=4.4Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.86 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.33 (1H, d, J=8.4Hz), 7.54 (1H, s), 7.94 (1H, d, J=8.4Hz), 7.97 (1H, s), 8.19-8.21 (1H, m), 8.56 (1H, s), 9.20 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 466.2 (MH⁺)

実施例 947

- 20 {8-第 3 ブチル-6-[2-5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イルメトキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.35 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.91 (3H, s), 3.10-3.48 (2H, m), 3.74 (2H, d, J=4.8Hz), 4.02-4.18 (2H, m), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.37-4.48 (1H, m), 4.78 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.18 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.32 (1H

, s), 9.04 (1H, brs), 9.33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 572.2 (MH⁺)

実施例 948

5 {8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メトキシ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキ
サジン-2-イルメトキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.20 (3H, t, J=6.8Hz), 1.27 (3H, t, J=6.8Hz), 1.35 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.91
 (3H, s), 3.11-3.45 (2H, m), 3.75 (2H, d, J=4.8Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.10-4.25 (6
 10 H, m), 4.38-4.48 (1H, m), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.18 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.32 (1H
 , s), 9.04 (1H, brs), 9.36 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 600.2 (MH⁺)

実施例 949

15 2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.48-2.62 (4H, m), 2.81 (3H, d, J=4.0Hz), 3.22-3.
 42 (4H, m), 4.03 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.54 (1H, s),
 20 7.57 (1H, s), 7.63 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.55 (1H, s).

実施例 950

25 1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-オン;臭
化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.48-2.62 (4H, m), 3.28-3.

45 (4H, m), 4.02 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.33 (2H, s), 7.56 (2H, s), 7.62 (2H, s).

実施例 951

5 2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.12-2.24 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.0Hz), 3.28-3.40 (2H, m), 3.64-3.72 (2H, m), 3.74 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.85 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.81 (1H, d, J=2.0Hz), 7.83 (1H, d, J=2.0Hz), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.55 (1H, s).

実施例 952

15 1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.12-2.24 (2H, m), 3.30-3.40 (2H, m), 3.68 (2H, t, J=6.8Hz), 3.74 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.80 (1H, s), 7.81 (1H, s).

20 実施例 953

3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-オキサゾリジン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 3.82 (3H, s), 3.91 (2H, t, J=5.2Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.54 (2H, t, J=5.2Hz), 4.80 (2H,

s), 5.45 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.82 (H, d, J=2.0Hz), 7.97 (1H, d, J=2.0).

実施例 954

2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.58-1.73 (2H, m), 1.93-2.09 (2H, m), 2.69-2.81 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 3.13-3.45 (6HandH₂O, m), 3.93 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.83 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.58 (1H, s), 8.09-8.31 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.14 (1H, brs), 9.83 (1H, brs).

実施例 955

1-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.36 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.58-1.73 (2H, m), 1.95-2.08 (2H, m), 2.68-2.81 (2H, m), 3.10-3.50 (6HandH₂O, m), 3.93 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.57 (1H, s), 8.96-9.34 (2H, m).

実施例 956

2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.59-1.71 (2H, m), 1.95-2.06 (2H, m), 2.70-2.82 (5H, m), 2.91 (6H, s), 3.16-3.42 (6HandH₂O, m), 3.93 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.51 (1H,

s), 7.58 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.30-8.45 (1H, m), 8.85-8.93 (1H, m), 9.48-9.57 (1H, m)

実施例 957

5 6-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.28-1.47 (12H, m), 1.59-1.72 (2H, m), 1.95-2.07 (2H, m), 2.70-2.84 (5H, m), 3.13-3.
52 (6H and H₂O, m), 3.94 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.51 (
10 1H, s), 7.58 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.47-8.60 (1H, m), 9.31-9.44 (1H, m), 9.88-10.02 (1
H, m).

実施例 958

15 1-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.59-1.76 (2H, m), 1.95-2.12 (2H, m), 2.68-2.85 (2H, m), 3.15-3.50 (6Ha
nd H₂O, m), 3.86 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.80 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.36 (1H,
s), 7.51 (1H, s), 7.57 (1H, s), 9.00-9.36 (2H, m).

20 実施例 959

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.36 (9H, s), 1.87-2.13 (4H, m), 2.77 (3H, d, J=4.4Hz), 2.85-3.00 (5H, m), 3.02-3.17 (
3H, m), 3.93 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.52 (1H, s), 7.60 (1H, s),

8.06 (1H, s), 8.30-8.45 (1H, m), 8.80-9.00 (1H, m), 9.44-9.62 (1H, m).

実施例 960

6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ

5 リジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.28-1.45 (12H, m), 1.87-2.14 (4H, m), 2.78 (3H, d, J=4.4Hz), 2.85-2.97 (2H, m), 3.02-3.17 (3H, m), 3.93 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.88 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.60 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.46-8.58 (1H, m), 9.32-9.42 (1H, m), 9.88-10.02 (1H, m).

10 実施例 961

1-(3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル)-ピペリジン-4-イル
1)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.36 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.39-1.50 (2H, m), 1.72-1.90 (3H, m), 2.23 (2H, d, J=6.4Hz), 2.52-2.68 (2H, m), 3.93 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.57 (1H, s), 9.04 (1H, brs), 9.27 (1H, brs), 12.09 (1H, brs).

実施例 962

20 1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.2Hz), 2.75 (6H, s), 3.82 (3H, s), 3.87 (3H, s), 4.20 (2H, q, J=7.2Hz), 4.78 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.45 (1H, d, J=2.0Hz), 7.53 (1H, d, J=2.0Hz).

MS:m/e (ESI) 472. 2 (MH⁺)

実施例 963

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 44 (9H, s), 2. 78-2. 92 (3H, m), 3. 59 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8 Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 92-8. 08 (2H, m), 8. 21 (1H, s), 8. 40 (1H, s), 8. 56 (1H, s), 9. 19 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

10 実施例 964

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 45 (9H, s), 3. 59 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 38 (1 H, s), 7. 96-8. 05 (3H, m), 8. 38 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 498. 1 (MH⁺)

実施例 965

20 1-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 01 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 74 (3H, s), 3. 13 (2H, q, J=7. 2Hz), 3. 83 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 47 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 02 (1H, brs), 9. 27 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 500. 2 (MH⁺)

実施例 966

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキ
ソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン
酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 01 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 74 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 13 (2H, q, J=7. 0Hz), 3. 83 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 48 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54-7. 55 (2H, m), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 14 (1H, brs), 9. 81 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 495. 2 (MH⁺)

実施例 967

3-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イ
ル}-プロピオニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7Hz), 2. 80 (2H, t, J=8Hz), 3. 47 (2H, m), 3. 70 (2H, t, J=8Hz), 4. 11 (2H, q, J=7Hz), 4. 20-4. 27 (4H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 25 (2H, m), 7. 33 (1H, brs), 9. 05 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 523. 0 (MH⁺)

実施例 968

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-オキサゾール-5-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエト
キシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭
化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45 (9H, s), 3. 59 (3H, s), 4. 10 (2H, q, J=

6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 94-8. 05 (3H, m), 8. 38 (1H, m), 9. 07 (1H, m), 9. 30 (1H, m).

実施例 969

5 1-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フル
オロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノ
ン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 01 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 74 (3H, s), 3. 13 (2H, q, J=7. 0Hz), 3. 83 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 47 (1H, d, J=2. 0Hz)
10 , 7. 54 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 07 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 472. 2 (MH⁺)

実施例 970

15 1-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(2-シク
ロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 01 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 2. 32 (1H, m), 2. 74 (3H, s), 3. 13 (2H, q, J=7. 0Hz), 3. 83 (3H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 48 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=7. 8Hz), 8. 09 (1H, d, J=7. 8Hz), 9. 43 (1H, brs), 9. 62 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 435. 1 (MH⁺)

実施例 971

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキ
シ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化
水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45 (9H, s), 3. 59 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=

6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.82 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.94-8.04 (3H, m), 8.38 (1H, s), 9.08 (1H, brs), 9.32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 526.2 (MH⁺)

実施例 972

- 5 6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.01 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34-1.37 (12H, m), 2.74 (3H, s), 2.78 (3H, d, J=4.8Hz), 3.13 (2H, q, J=7.0Hz), 3.83 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=7.0Hz), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.47 (1H, d, J=2.0Hz), 7.54 (1H, d, J=2.0Hz), 7.99 (1H, s), 8.53 (1H, q, J=4.8Hz), 9.40 (1H, brs), 9.92 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 496.2 (MH⁺)

実施例 973

- 15 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.35-1.54 (15H, m), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 3.69 (3H, s), 4.15-4.40 (4H, m), 4.86 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.55 (1H, s), 7.61 (1H, s), 7.64 (1H, s), 8.13-8.28 (1H, m), 8.56 (1H, s), 9.21 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

実施例 974

- 25 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.35-1.50 (15H, m), 3.68 (3H, s), 4.11 (3H, t, J=6.8Hz), 4.15-4.40 (4H, m), 4.81 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.60 (1H, s), 7.62 (1H, s), 8.92-9.43 (2H, m).

実施例 975

- 5 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.42 (3H, t, J=6.8Hz), 1.44 (9H, s), 3.69 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.82 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.60 (1H, s), 7.63 (1H, s), 9.00-9.40 (2H, m).

実施例 976

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル 1}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.01 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 2.74 (3H, s), 2.77 (3H, d, J=5.0Hz), 2.91 (6H, s), 3.12 (2H, q, J=7.0Hz), 3.83 (3H, s), 4.73- (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.47 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.37 (1H, q, J=5.0Hz), 8.92 (1H, brs), 9.51 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 494.2 (MH⁺)

- 20 実施例 977

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 0.98 (6H, t, J=7.2Hz), 1.37 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.83 (3H, d, J=4.8Hz), 3.16 (4H, q, J=7.2Hz), 3.86 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.84 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.50 (

1H, d, J=2.0Hz), 7.54 (1H, s), 7.55 (1H, d, J=2.0Hz), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.07 (1H, brs), 9.80 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 509.2 (MH⁺)

実施例 978

- 5 1-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 0.98 (6H, t, J=7.0Hz), 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 3.16 (4H, q, J=7.0Hz), 3.86 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.48 (1H, d, J=1.6Hz), 7.54 (1H, d, J=1.6Hz), 9.02 (1H, brs), 9.28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 514.2 (MH⁺)

実施例 979

- 15 1-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 0.98 (6H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 3.16 (4H, q, J=7.0Hz), 3.86 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.96 (3H, s), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.49 (1H, d, J=2.0Hz), 7.54 (1H, d, J=2.0Hz), 9.06 (1H, brs), 9.30 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 486.2 (MH⁺)

実施例 980

- 25 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル 1]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 18 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39
-1. 56 (2H, m), 1. 73-1. 92 (3H, m), 2. 30 (2H, d, J=6. 4Hz), 2. 52-2. 68 (2H, m), 3. 92 (3H, s),
4. 00-4. 15 (4H, m), 4. 20 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7.
50 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 8. 90-9. 35 (2H, m).

MS:m/e (ESI) 612. 3 (MH⁺)

実施例 981

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェニル
エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 44 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 3. 73 (3H, s), 4.
. 12 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7.
67 (1H, s), 7. 75 (1H, s).

- MS:m/e (ESI) 550. 1 (MH⁺)

実施例 982

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミ
ノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル
エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 3. 73 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 51 (2
H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 75 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 522. 1 (MH⁺)

実施例 983

- 6-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチ
ル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン

酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

0.98(6H, t, J=7.0Hz), 1.34-1.37(12H, m), 2.78(3H, d, J=4.4Hz), 3.16(4H, q, J=7.0Hz), 3.86(3H, s), 4.24(2H, q, J=7.0Hz), 4.88(2H, s), 5.52(2H, s), 7.49(1H, s), 7.55(1H, s), 8.00(1H, s), 8.53(1H, q, J=4.4Hz), 9.39(1H, brs), 9.94(1H, brs).

MS:m/e(ESI) 510.2(MH⁺)

実施例 984

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1.31-1.43(15H, m), 2.75(6H, s), 2.83(3H, d, J=4.6Hz), 4.13(2H, q, J=7.0Hz), 4.28(2H, q, J=7.0Hz), 4.84(2H, s), 5.49(2H, s), 7.45(1H, s), 7.54(1H, s), 7.56(1H, s), 8.21(1H, q, J=4.6Hz), 8.55(1H, s), 9.13(1H, brs), 9.81(1H, brs).

MS:m/e(ESI) 495.2(MH⁺)

実施例 985

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1.36(9H, s), 1.41(3H, t, J=6.8Hz), 1.54-1.67(2H, m), 1.84-1.96(2H, m), 2.66-2.76(2H, m), 2.82(3H, d, J=4.8Hz), 3.18-3.36(2H, m), 3.52-3.68(1H, m), 3.94(3H, s), 4.27(2H, q, J=6.8Hz), 4.73(1H, d, J=4.0Hz), 4.84(2H, s), 5.49(2H, s), 7.52(1H, s), 7.54(1H, s), 7.58(1H, s), 8.12-8.25(1H, m), 8.55(1H, s), 9.14(1H, brs), 9.83(1H, brs).

実施例 986

1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

ル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 54-1. 68 (2H, m), 1. 84-1. 96 (2H, m), 2. 65-2. 78 (2H, m), 3. 17-3. 42 (2H, m), 3. 58-3. 67 (1H, m), 3. 94 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 73 (1H, d, J=3.2Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 95-9. 11 (1H, m), 9. 18-9. 36 (1H, brs).

実施例 987

6-[2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 26-1. 50 (12H, m), 1. 50-1. 68 (2H, m), 1. 84-2. 03 (2H, m), 2. 64-2. 86 (5H, m), 3. 12-3. 68 (3H, m), 3. 94 (3H, s), 4. 23 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 44-7. 70 (2H, m), 7. 99 (1H, s), 8. 41-8. 63 (1H, m), 9. 37 (1H, brs), 9. 94 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 538. 3 (MH⁺)

実施例 988

1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 54-1. 70 (2H, m), 1. 84-2. 00 (2H, m), 2. 65-2. 80 (2H, m), 3. 19-3. 50 (2H, m), 3. 55-3. 70 (1H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 93 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 73 (1H, d, J=4.0Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 99-9. 40 (2H, m).

実施例 989

1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

ル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1.00-1.19 (4H, m), 1.36 (9H, s), 1.54-1.68 (2H, m), 1.84-1.96 (2H, m), 2.24-2.37 (1H, m), 2.64-2.78 (2H, m), 3.18-3.46 (2H, m), 3.53-3.70 (1H, m), 3.94 (3H, s), 4.73 (1H, d, J=4.0Hz), 4.82 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.73 (1H, d, J=8.0Hz), 8.10 (1H, d, J=8.0Hz), 9.50-9.76 (2H, m).

MS:m/e (ESI) 477.2 (MH⁺)

実施例 990

10 メタン sulfon 酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.08-1.10 (4H, m), 1.45 (9H, s), 2.30-2.33 (1H, m), 2.67 (6H, s), 3.73 (3H, s), 4.83 (2H, s), 5.80 (2H, s), 7.68 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=7.8Hz), 7.53 (1H, s), 8.10 (1H, d, J=7.8Hz).

MS:m/e (ESI) 485.1 (MH⁺)

実施例 991

20 1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34-1.41 (15H, m), 2.75 (6H, s), 4.08-4.16 (4H, m), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.78 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.44 (1H, s), 7.54 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 500.2 (MH⁺)

実施例 992

1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.36 (3H, t, J=7.0Hz), 1.38 (9H, s), 2.75 (6H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.13 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.44 (1H, d, J=1.6Hz), 7.54 (1H, d, J=1.6Hz).

MS:m/e (ESI) 472.2 (MH⁺)

実施例 993

- 10 1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.38-1.41 (12H, m), 2.61 (6H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.78 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.63 (1H, s), 7.68 (1H, s), 9.01 (1H, brs), 9.26 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 472.2 (MH⁺)

実施例 994

- 20 2-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.37 (3H, t, J=7.0Hz), 1.38 (9H, s), 2.75 (6H, s), 2.78 (3H, d, J=4.6Hz), 2.91 (6H, s), 4.13 (2H, q, J=7.0Hz), 4.73 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.45 (1H, s), 7.55 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.37 (1H, q, J=4.6Hz).

MS:m/e (ESI) 494.2 (MH⁺)

実施例 995

6-[2-(3-第 3 ブチル-5 ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 34-1. 39 (15H, m), 2. 75 (6H, s), 2. 78 (3H, d, $J=4.6\text{Hz}$), 4. 13 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4. 24 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 45 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 53 (1H, q, $J=4.6\text{Hz}$), 8. 55 (1H, s), 9. 39 (1H, brs), 9. 92 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 496. 2 (MH $^+$)

10 実施例 996

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1. 44 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 2. 78 (3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 2. 92 (6H, s), 3. 72 (3H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 16 (1H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, $J=4.8\text{Hz}$).

MS: m/e (ESI) 544. 2 (MH $^+$)

実施例 997

20 1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 37 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 1. 39 (9H, s), 2. 75 (6H, s), 4. 13 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4. 81 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 45 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7. 55 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7. 72 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8. 09 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$).

MS:m/e (ESI) 435. 2 (MH⁺)

実施例 998

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミ
ノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセ
チル]-フェニル エステル; トリフルオロ酢酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 45 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 2. 78 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 24 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 8. 01 (1H, s), 8. 53 (1H, q, J=4. 8Hz), 9. 43 (1H, brs), 9. 98 (1H, brs).

10 MS:m/e (ESI) 546. 1 (MH⁺)

実施例 999

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒ
ドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステ
ル; 臭化水素酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 40-1. 44 (12H, m), 2. 31-2. 34 (1H, m), 3. 69 (3H, s), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 7. 73 (1H, d, J=8. 2Hz), 8. 11 (1H, d, J=8. 2Hz), 9. 50 (1H, brs), 9. 68 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 486. 1 (MH⁺)

20 実施例 1000

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチル
カルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フ
ェニル エステル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 40-1. 44 (12H, m), 2. 78 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 69 (3H, s), 4. 26 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 74 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 16 (1H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8

. 38 (1H, q, J=4. 4Hz).

MS:m/e (ESI) 545. 2 (MH⁺)

実施例 1001

5 1-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 98 (6H, t, J=7. 0Hz), 1. 06-1. 10 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 2. 29-2. 34 (1H, m), 3. 15-3. 19 (4H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 86 (3H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 55 (1H, s),
10 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 11 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 30 (1H, brs), 9. 62 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 449. 2 (MH⁺)

実施例 1002

15 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 98 (6H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 78 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92 (6H, s), 3. 16 (4H, q, J=7. 0Hz), 3. 85 (3H, s), 4. 74 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 49 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 55 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 92 (1H, brs), 9
20 . 53 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 508. 2 (MH⁺)

実施例 1003

25 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=7.0Hz), 1.40-1.44 (12H, m), 2.78 (3H, d, J=4.4Hz), 3.69 (3H, s), 4.21-4.29 (4H, m), 4.90 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.60 (1H, s), 7.63 (1H, s), 8.00 (1H, s), 8.53 (1H, q, J=4.4Hz), 9.43 (1H, brs), 9.98 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 547.1 (MH⁺)

5 実施例 1004

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 2.76 (3H, d, J=5.2Hz), 3.72 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.46 (2H, s), 5.50 (1H, q, J=5.2Hz), 7.04 (1H, s), 7.23 (1H, s), 7.33 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 472.1 (MH⁺)

実施例 1005

15 1-[3-第3ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル);臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.36 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 1.54-1.68 (2H, m), 1.83-1.96 (2H, m), 2.64-2.78 (2H, m), 3.21-3.48 (2H, m), 3.58-3.69 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.94 (3H, s), 4.22 (2H, q, J=6.8Hz), 4.73 (1H, d, J=4.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.56 (1H, s), 9.00-9.12 (1H, m), 9.20-9.34 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 528.2 (MH⁺)

実施例 1006

25 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニル エス

テル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 43 (9H, s), 3. 65 (3H, s), 3. 96 (3H, s), 4. 11 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 63 (1H, s), 8. 99-9. 41 (2H, m).

実施例 1007

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 03-1. 20 (4H, m), 1. 43 (9H, s), 2. 27-2. 37 (1H, m), 3. 66 (3H, s), 3. 97 (3H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 65 (2H, s), 7. 64 (2H, brs), 7. 72 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 11 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 52-9. 82 (2H, m).

実施例 1008

- 15 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 40 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 55 (3H, s), 4. 00 (3H, s), 4. 30 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 87 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 17-8. 28 (1H, m), 8. 58 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

実施例 1009

メタンスルホン酸 3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

- 25 テル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 54 (3H, s), 4. 00 (3H, s), 4. 13 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 23 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 86 (1H, s), 7. 90 (1H, s), 9. 01-9. 16 (1H, m), 9. 28-9. 43 (1H, m).

実施例 1010

5 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 41 (9H, s), 1. 54-1. 70 (2H, m), 1. 84-1. 98 (2H, m), 2. 64-2. 84 (5H, m) 2. 91 (6H, s), 3. 19-3. 46 (2H, m), 3. 54-3. 72 (1H, m), 3. 93 (3H, s), 4. 52-4. 58 (3H, m), 5. 45 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 31-8. 50 (1H, m), 8. 80-9. 05 (1H, m), 9. 40-9. 65 (1H, m).

実施例 1011

15 2-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 41 (3H, t, J=7Hz), 1. 68 (3H, s), 1. 74 (3H, s), 2. 77 (6H, s), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 3. 83 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 51 (1H, brs), 7. 54 (1H, brs), 7. 66 (1H, brs), 8. 21 (1H, m), 8. 56 (1H, brs), 9. 21 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 484. 4 (MH⁺)

実施例 1012

25 6-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=7Hz), 1. 68 (3H, s), 1. 74 (3H, s), 2. 78 (9H, m), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 3. 84 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=7Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 50 (1H, brs), 7. 66 (1H, brs), 8. 00 (1H, s), 8. 54 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 485. 3 (MH+)

5 実施例 1013

2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 40 (3H, t, J=7Hz), 1. 68 (3H, s), 1. 74 (3H, s), 2. 77 (6H, s), 3. 83 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7Hz), 4. 21 (2H, q, J=7Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 34 (1H, brs), 7. 50 (1H, brs), 7. 65 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 490. 4 (MH+)

実施例 1014

15 2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 02-1. 13 (4H, m), 1. 68 (3H, s), 1. 74 (3H, s), 2. 31 (1H, m), 2. 77 (6H, s), 3. 83 (3H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 51 (1H, brs), 7. 66 (1H, brs), 7. 72 (1H, d, J=8Hz), 8. 10 (1H, d, J=8Hz), 9. 48 (1H, brs), 9. 67 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 425. 3 (MH+)

実施例 1015

25 6-ジメチルアミノ-2-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 67 (3H, s), 1. 73 (3H, s), 2. 77 (9H, m), 2. 92 (6H, s), 3. 83 (3H, s), 4. 74 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=2Hz), 7. 66 (1H, d, J=2Hz), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=5Hz), 8. 94 (1H, brs), 9. 55 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 484. 4 (MH⁺)

実施例 1016

メタン sulfon 酸 2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 73 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 76 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s).

実施例 1017

15 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-[1,3]オキサジナン-3-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 32 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 56-1. 68 (2H, m), 3. 42-3. 48 (2H, m), 3. 89 (3H, s), 3. 80-3. 92 (2H, m), 4. 13 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 23 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 36 (2H, s), 7. 60 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 77 (1H, d, J=2. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 528. 2 (MH⁺)

実施例 1018

25 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン

ドーラー-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 80-1. 92 (1H, m), 1. 98-2. 11 (1H, m), 2. 74-2. 84 (4H, m) 2. 94 (6H, s), 3. 0
8-3. 18 (1H, m), 3. 26-3. 50 (2H, m), 3. 65 (3H, s), 4. 32-4. 47 (1H, m), 4. 75 (2H, s), 4. 64-
5. 01 (1H, m), 5. 47 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 8. 09 (1H, s), 8. 30-8
. 54 (1H, m), 8. 94 (1H, brs), 9. 55 (1H, brs).

実施例 1019

1-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 79-1. 92 (1H, m), 1. 98-2. 12 (1H, m), 2. 90-2. 99 (1H, m), 3. 08-3. 18 (1H,
m), 3. 20-3. 60 (2H, m), 3. 65 (3H, s), 3. 89 (3H, s), 3. 97 (3H, s), 4. 30-4. 43 (1H, m), 4. 81
(2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 43 (1H, s), 9. 08 (1H, brs), 9. 31 (1H,
brs).

実施例 1020

2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イ
ル)-1-[3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェ
ニル]-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 21 (6H, d, J=7. 2Hz), 1. 31 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 54-1. 68 (2H, m)
, 1. 86-1. 96 (2H, m), 2. 70-2. 82 (2H, m), 3. 20-3. 68 (3H, m), 3. 88 (3H, s), 4. 13 (2H, q, J=
7. 2Hz), 4. 23 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 74 (1H, d, J=4. 0Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 35 (
1H, s), 7. 43 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 98-9. 12 (1H, m), 9. 20-9. 38 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 528. 4 (MH⁺)

実施例 1021

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 20 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7.0Hz), 2. 82 (3H, d, J=4.8Hz), 3. 12-3. 17 (2H, m), 3. 73 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 29 (1H, t, J=6.0Hz), 5. 46 (2H, s), 7. 11 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=4.8Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 18 (1H, brs), 9. 80 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481. 3 (MH⁺)

10 実施例 1022

1-(3-第 3 ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 20 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7.0Hz), 3. 12-3. 19 (2H, m), 3. 72 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 29 (1H, t, J=6.0Hz), 5. 45 (2H, s), 7. 10 (1H, s), 7. 22 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 9. 03 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 486. 3 (MH⁺)

20 実施例 1023

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 20 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 78 (3H, d, J=4.6Hz), 2. 92 (6H, s), 3. 12-3. 19 (2H, m), 3. 72 (3H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 28 (1H, t, J=5.8Hz), 5. 42 (2H, s), 7. 10 (1H, s), 7. 15 (

1H, s), 7.23 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.37 (1H, q, J=4.6Hz), 8.92 (1H, brs), 9.52 (1H, brs)

MS:m/e (ESI) 480.3 (MH⁺)

実施例 1024

- 5 1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.39 (9H, s), 2.61 (6H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.80 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.63 (1H, d, J=2.0Hz), 7.68 (1H, d, J=2.0Hz).

MS:m/e (ESI) 444.2 (MH⁺)

実施例 1025

- 15 6-[2-(3-第3ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.20 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34-1.37 (12H, m), 2.78 (3H, d, J=5.0Hz), 3.12-3.18 (2H, m), 3.73 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=7.0Hz), 4.87 (2H, s), 5.29 (1H, t, J=6.0Hz), 5.49 (2H, s), 7.10 (1H, s), 7.23 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.52 (1H, q, J=5.0Hz).

MS:m/e (ESI) 482.3 (MH⁺)

実施例 1026

- 25 2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.36 (9H, s), 2.75-2.78 (6H, m), 2.91 (6H, s), 3.72 (3H, s), 4.71 (2H, s), 5.40 (2H, s), 5

. 49 (1H, q, J=4. 8Hz), 7. 05 (1H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 24 (1H, s), 8. 05 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4. 8Hz).

MS:m/e (ESI) 466. 3 (MH⁺)

実施例 1027

- 5 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 79-1. 92 (1H, m), 1. 98-2. 12 (1H, m), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92-2. 99 (1H, m), 3. 08-3. 18 (1H, m), 3. 20-3. 65 (2H, m), 3. 66 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 35-4. 45 (1H, m), 4. 86 (2H, s), 5. 43-5. 58 (2H, m), 7. 36 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 16-8. 30 (1H, m), 8. 58 (1H, s), 9. 17 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

実施例 1028

- 15 6-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34-1. 38 (12H, m), 2. 75-2. 78 (6H, m), 3. 72 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 05 (1H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 52 (1H, q, J=5. 2Hz).

- 20 MS:m/e (ESI) 468. 3 (MH⁺)

実施例 1029

- (1-{5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 19 (6H, d, J=7. 2Hz), 1. 32-1. 48 (5H, m), 1. 70-1. 87 (3H, m), 2. 16-2. 26 (2H, m), 2. 54-

2. 68 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=3. 6Hz), 3. 85 (3H, s), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 41 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 13-8. 24 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 565. 3 (MH⁺)

5 実施例 1030

(1-{5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸:トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 19 (6H, d, J=6. 8Hz), 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 33-1. 48 (5H, m), 1. 72-1. 86 (3H, m), 2. 18-2. 25 (2H, m), 2. 54-2. 66 (2H, m), 3. 85 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 99-9. 08 (1H, m), 9. 24-9. 36 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 570. 4 (MH⁺)

15 実施例 1031

1-(3-第 3 ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 20 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 3. 12-3. 19 (2H, m), 3. 73 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 29 (1H, t, J=6. 0Hz), 5. 45 (2H, s), 7. 10 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 9. 00 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 458. 2 (MH⁺)

実施例 1032

25 1-(3-第 3 ブチル-5 エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸

塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 20 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 26-2. 35 (1H, m), 3. 12-3. 18 (2H, m), 3. 73 (3H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 29 (1H, t, J=6. 0Hz), 5. 54 (2H, s), 7. 11 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 421. 2 (MH⁺)

実施例 1033

1-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸

塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 36-1. 41 (15H, m), 4. 08-4. 15 (4H, m), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 9. 00 (1H, brs), 9. 30 (1H, brs), 9. 44 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 473. 2 (MH⁺)

実施例 1034

2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36-1. 43 (15H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 6Hz), 4. 12 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 43 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 6Hz), 8. 55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 468. 2 (MH⁺)

実施例 1035

エチル-カルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミ

ノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1.08 (3H, t, J=7.0Hz), 1.27-1.33 (15H, m), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 3.06-3.14 (2H, m), 4.03-4.14 (4H, m), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.80 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.86 (1H, t, J=4.8Hz), 9.02 (1H, brs), 9.33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 544.3 (MH⁺)

実施例 1036

10 エチル-カルバミン酸 2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.09 (3H, t, J=7.0Hz), 1.31 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.05-3.11 (2H, m), 4.07 (2H, q, J=7.0Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.86 (1H, t, J=6.0Hz), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 539.4 (MH⁺)

実施例 1037

20 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 1.44 (9H, s), 2.10-2.17 (2H, m), 2.69 (2H, t, J=7.2Hz), 3.67 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.82 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.63 (1H, s), 7.66 (1H, s), 9.08 (1H, brs), 9.32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 590.2 (MH⁺)

実施例 1038

1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

2.09 (3H, s), 2.80 (6H, s), 3.72 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.81 (2H, s), 5.04 (1H, m), 5.23 (1H, m), 5.49 (2H, s), 7.37 (1H, brs), 7.40-7.42 (2H, m).

MS: m/e (ESI) 442.3 (MH⁺)

実施例 1039

10 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-(3-シアノプロポキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル; 臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1.42 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 1.44 (9H, s), 2.11-2.17 (2H, m), 2.69 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.83 (3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 3.67 (3H, s), 4.25-4.30 (4H, m), 4.86 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.55 (1H, s), 7.64 (1H, s), 7.67 (1H, s), 8.21 (1H, q, $J=4.8\text{Hz}$), 8.56 (1H, s), 9.20 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 585.3 (MH⁺)

実施例 1040

20 1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1.18 (3H, s), 1.28 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.35 (9H, s), 1.39 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.59-1.80 (4H, m), 2.88-3.09 (4H, m), 3.93 (3H, s), 4.11 (3H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4.21 (3H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4.78 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.53 (1H, s), 7.55 (1H, s), 8.98-9.10 (1H, m), 9.20

-9.33 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 556.4 (MH⁺)

実施例 1041

5 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピペラジン-1-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 3.21 (4H, brs), 3.32 (4H, brs), 3.94 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.64 (1H, s), 9.04-9.16 (3H, m), 9.40 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 527.3 (MH⁺)

実施例 1042

15 2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.16 (3H, t, J=6.8), 1.36 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.68-2.95 (6H, m), 3.18 (3H, s), 3.20-3.48 (4H, m), 3.81 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.46-7.60 (3H, m), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.55 (1H, s), 9.16 (1H, brs), 9.83 (1H, s).

20 MS:m/e (ESI) 525.4 (MH⁺)

実施例 1043

2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 2.77 (3H, d, J=4.0Hz), 2.80 (3H, s), 2.91 (6H, s), 3.18 (3H, s), 3.20-3.48